

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representation of  
The original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.**

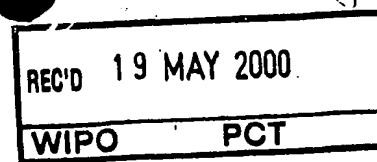
**This Page Blank (uspto)**

PCT/EP 00/03000

# BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

**PRIORITY  
DOCUMENT**  
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN  
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

EP 00/3608



4

## Bescheinigung

Die Bayer Aktiengesellschaft in Leverkusen/Deutschland hat eine Patentanmeldung unter der Bezeichnung

"Substituierte Benzoylisoxazole"

am 06. Mai 1999 beim Deutschen Patent- und Markenamt eingereicht

Das angeheftete Stück ist eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlage dieser Patentanmeldung.

Die Anmeldung hat im Deutschen Patent- und Markenamt vorläufig die Symbole C 07 D 413/10, C 07 D 417/10, A 01 N 43/80 und A 01 N 43/647 der Internationalen Patentklassifikation erhalten.

München, den 17. Februar 2000

Deutsches Patent- und Markenamt

Der Präsident

Im Auftrag

Zitzenzier

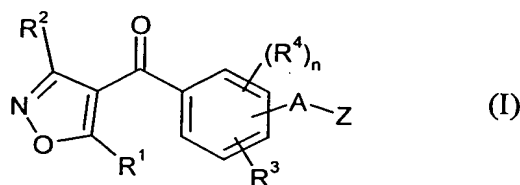
Aktenzeichen: 199 20 791.7

# Substituierte Benzoylisoxazole

Die Erfindung betrifft neue substituierte Benzoylisoxazole, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

Es ist bereits bekannt, daß bestimmte substituierte Benzoylisoxazole herbizide Eigenschaften aufweisen (vgl. EP-A-418 175, EP-A-487 357, EP-A-527 036, EP-A-527 037, EP-A-560 483, EP-A-609 797, EP-A-609 798, EP-A-636 622, US-A-5 834 402, US-A-5 863 865, WO-A-96/26192, WO-A-97/27187, WO-A-97/43270, WO-A-99/03856). Die Wirkung dieser Verbindungen ist jedoch nicht in allen Belangen zufriedenstellend.

Es wurden nun die neuen substituierten Benzoylisoxazole der allgemeinen Formel (I),



in welcher

n für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3 steht,

A für eine Einfachbindung oder für Alkandiyl (Alkylen) steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl oder Cycloalkyl steht,

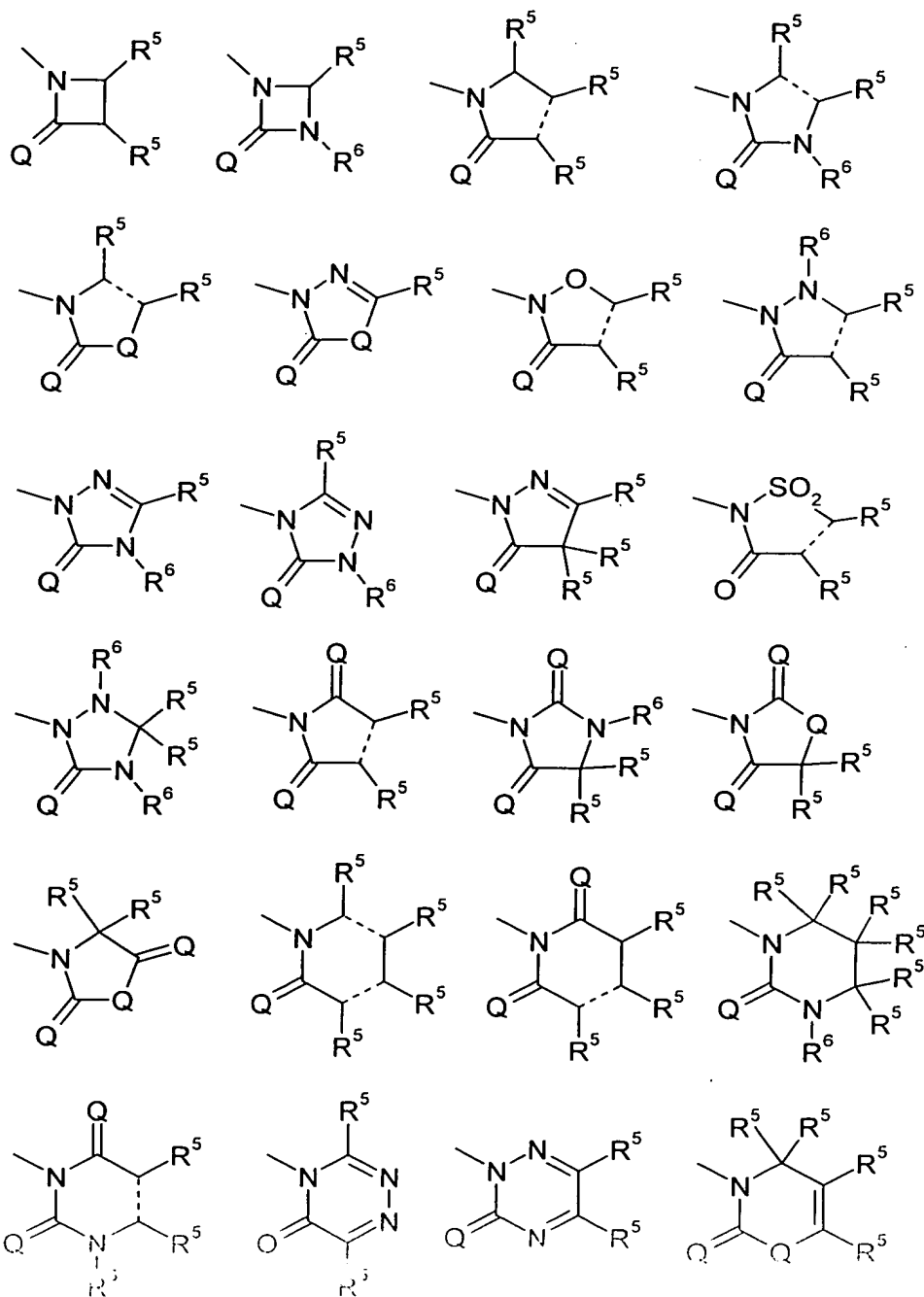
- R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl oder Alkylthio steht,
- 5 R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht,
- 10 R<sup>4</sup> Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht, und
- 15 Z für eine gegebenenfalls substituierte 4- bis 12-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische, heterocyclische Gruppierung steht, welche 1 bis 4 Heteroatome (bis zu 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls - alternativ oder additiv - ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom, oder
- 20 eine SO-Gruppierung oder eine SO<sub>2</sub>-Gruppierung) enthält, und welche zusätzlich ein bis drei Oxo-Gruppen (C=O) und/oder Thioxo-Gruppen (C=S) als Bestandteile des Heterocyclus enthält,
- gefunden.
- 25 In den Definitionen sind die Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl oder Alkandiyl - auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy - jeweils geradkettig oder verzweigt.
- n steht bevorzugt für die Zahlen 0, 1 oder 2.

- A steht bevorzugt für eine Einfachbindung oder für Alkandiyl (Alkylen) mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.
- 5 R<sup>1</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.
- 10 R<sup>2</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy oder Alkoxycarbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, oder
- 15 für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylthio mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen.
- 20 R<sup>3</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.
- 25 R<sup>4</sup> steht bevorzugt für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu
- 30 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für Alkylamino, Dialkyl-

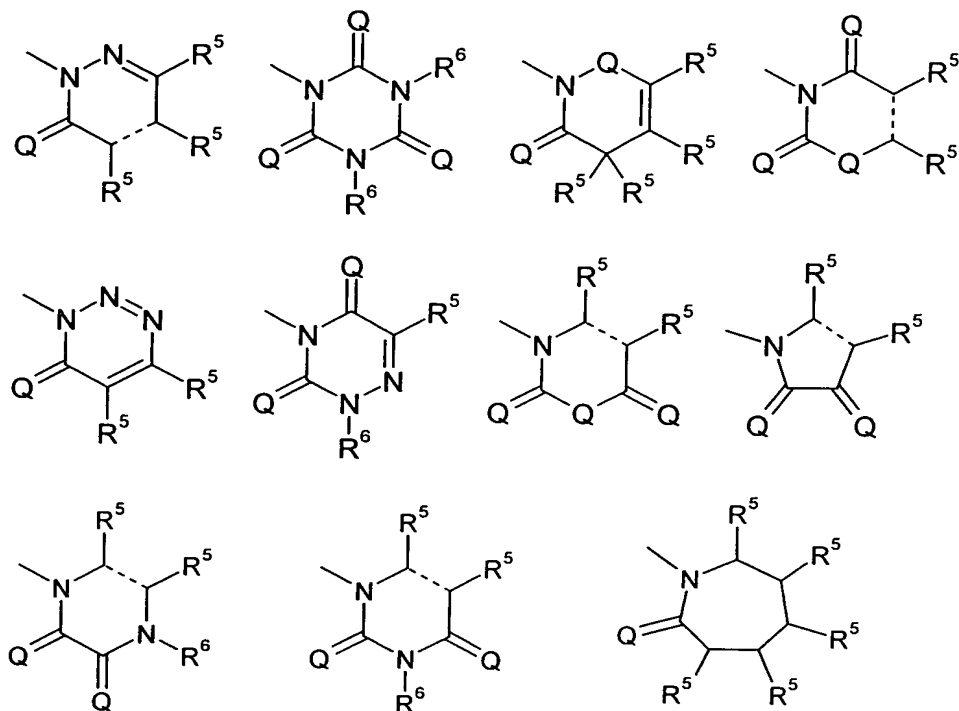
amino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, und

Z steht bevorzugt für eine der nachstehenden heterocyclischen Gruppierungen

5



10



5 worin jeweils die gestrichelt gezeichnete Bindung eine Einfachbindung oder eine Doppelbindung ist, und jede heterocyclische Gruppierung vorzugsweise nur zwei Substituenten der Definition  $R^5$  und/oder  $R^6$  trägt,

Q für Sauerstoff oder Schwefel steht,

10  $R^5$  für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylsulfinyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Alkenylthio, Alkynylthio oder Alkenylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkynylgruppen, für jeweils gegebenen-

15

20



5

falls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkylalkylthio oder Cycloalkylalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Phenyl, Phenyloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino steht, für Pyrrolidino, Piperidino oder Morpholino steht, oder – für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R<sup>5</sup> und R<sup>5</sup> sich an einer Doppelbindung befinden – auch zusammen mit dem benachbarten Rest R<sup>5</sup> für eine Benzogruppierung steht, und

10

15

R<sup>6</sup> für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkylidenamino mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylamino, Dialkylamino oder Alkanoylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkynyl oder Alkenyloxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkynylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl oder Cycloalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R<sup>5</sup> oder R<sup>6</sup> für gegebenenfalls durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes Alkandiyl mit 3 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,

20

25

30

wobei die einzelnen Reste R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> – soweit mehrere davon an gleiche heterocyclische Gruppierungen gebunden sind, gleiche oder verschiedene Bedeutungen im Rahmen der obigen Definition haben können.

Q steht bevorzugt für Sauerstoff (O).

5 R<sup>5</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituier-  
10 tes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Di-n-propylamino oder Di-i-propylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituier-  
15 tes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propenyl-oxo, Butenyl-oxo, Propenylthio, Butenylthio, Propenylamino oder Butenylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituier-  
20 tes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclopropylthio, Cyclobutylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio, Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Cyclobutylmethoxy, Cyclopentylmethoxy, Cyclohexylmethoxy, Cyclopropylmethylthio, Cyclobutylmethylthio, Cyclopentylmethylthio, Cyclohexylmethylthio, Cyclopropylmethylamino, Cyclobutylmethylamino, Cyclopentylmethylamino oder Cyclohexylmethylamino, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituier-  
25 tes Phenyl, Phenyl-oxo, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyl-oxo, Benzylthio oder Benzylamino, für Pyrrolidino, Piperidino oder Morpholino, oder - für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R<sup>5</sup> und R<sup>5</sup>

30

sich an einer Doppelbindung befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest R<sup>5</sup> auch für eine Benzogruppierung.

- 5 R<sup>6</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i- oder s-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylamino, Ethylamino oder Dimethylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Ethinyl, Propinyl oder Propenyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R<sup>5</sup> oder R<sup>6</sup> für jeweils gegebenenfalls durch Methyl und/oder Ethyl substituiertes Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen).
- 10
- 15
- 20 A steht besonders bevorzugt für eine Einfachbindung, Methylen, Ethyliden (Ethan-1,1-diyl) oder Dimethylen (Ethan-1,2-diyl).
- 25 R<sup>1</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.
- 30

- 5 R<sup>2</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio.
- 10 R<sup>3</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl.
- 20 R<sup>4</sup> steht besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-
- 25
- 30

Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl.

- 5       $R^5$  steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Fluorethyl, Chlorethyl, Difluorethyl, Dichlorethyl, Fluor-n-propyl, Fluor-i-propyl, Chlor-n-propyl, Chlor-i-propyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Fluorethoxy, Chlorethoxy, Difluorethoxy, Dichlorethoxy, Tri-  
 10 fluorethoxy, Trichlorethoxy, Chlorfluorethoxy, Chlordifluorethoxy, Fluor-dichlorethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Fluorethylthio, Chlorethylthio, Difluorethylthio, Dichlorethylthio, Chlorfluorethylthio, Chlordifluorethylthio, Fluordichlorethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Dimethylamino, Propenylthio, Butenylthio, Propinylthio, Butinylthio, Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Phenyl oder  
 15 Phenoxy.
- 20       $R^6$  steht besonders bevorzugt für Amino, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Methylamino, Dimethylamino, Cyclopropyl oder Cyclopropylmethyl steht, oder zusammen mit  $R^5$  für Propan-1,3-diyl (Trimethylen), Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) oder Pentan-1,5-diyl (Pentamethylen).
- 25      A steht ganz besonders bevorzugt für eine Einfachbindung oder für Methylen.
- 30       $R^1$  steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl,

n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl.

5 R<sup>2</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio.

10

R<sup>3</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl.

15

R<sup>4</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl.

20

A steht am meisten bevorzugt für Methylen.

25

R<sup>1</sup> steht am meisten bevorzugt für Cyclopropyl.

R<sup>2</sup> steht am meisten bevorzugt für Methoxycarbonyl.

30

R<sup>3</sup> steht am meisten bevorzugt für Chlor, Brom, Cyano, Trifluormethyl oder Methylsulfonyl.

$R^4$  steht am meisten bevorzugt für Wasserstoff, Chlor, Nitro, Methyl, Trifluor-methyl oder Methylsulfonyl.

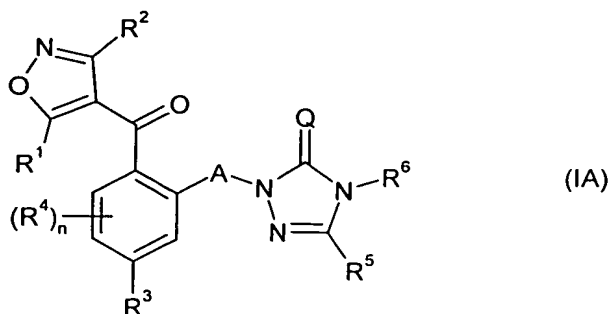
5 Erfindungsgemäß bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

10 Erfindungsgemäß besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

15 Erfindungsgemäß ganz besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als ganz besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

20 Erfindungsgemäß am meisten bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als am meisten bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

25 Aus den als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder als am meisten bevorzugt angegebenen Bedeutungen sind die Verbindungen der allgemeinen Formel (IA) noch einmal besonders hervorzuheben,

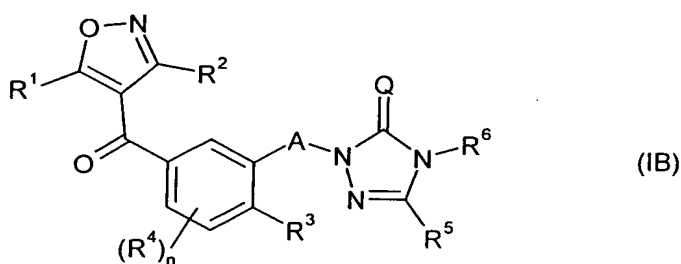


in welchen

n, A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> die vorausgehend angegebenen Bedeutungen haben, wobei die Verbindungen der Formel (IA), bei welchen A für Methylen steht, hierbei ganz besonders hervorzuheben sind.

5

Aus den als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder als am meisten bevorzugt angegebenen Bedeutungen sind außerdem die Verbindungen der allgemeinen Formel (IB) noch einmal besonders hervorzuheben,



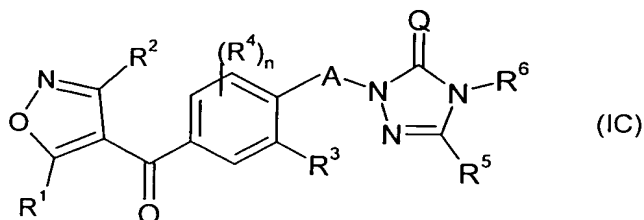
10

in welchen

n, A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> die vorausgehend angegebenen Bedeutungen haben.

15

Aus den als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder als am meisten bevorzugt angegebenen Bedeutungen sind außerdem Verbindungen der allgemeinen Formel (IC) noch einmal besonders hervorzuheben,



20

in welchen



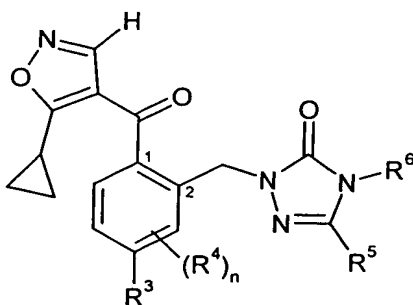
n, A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> die vorausgehend angegebenen Bedeutungen haben.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- oder Zwischenprodukte. Diese Restdefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen beliebig kombiniert werden.

10

Beispiele für die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) sind in den nachstehenden Gruppen aufgeführt.

### Gruppe 1












(IA-1)






15

$R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die in der nachstehenden Tabelle angegebenen Bedeutungen:

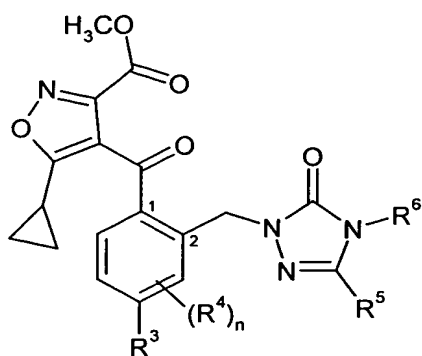
$R^3$	(Position-) ( $R^4$ ) <sub>n</sub>	$R^5$	$R^6$
H	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
F	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
I	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
NO <sub>2</sub>	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
CN	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
CH <sub>3</sub>	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
OCH <sub>3</sub>	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
CF <sub>3</sub>	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
OCHF <sub>2</sub>	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
OCF <sub>3</sub>	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
H	-	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
F	-	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	-	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	-	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
I	-	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
NO <sub>2</sub>	-	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
CN	-	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
CH <sub>3</sub>	-	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
OCH <sub>3</sub>	-	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
CF <sub>3</sub>	-	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
OCHF <sub>2</sub>	-	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
OCF <sub>3</sub>	-	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
H	-	SCCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
F	-	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	-	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	-	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
I	-	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
NO <sub>2</sub>	-	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
CN	-	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
CH <sub>3</sub>	-	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
OCH <sub>3</sub>	-	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
CF <sub>3</sub>	-	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
OCHF <sub>2</sub>	-	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
OCF <sub>3</sub>	-	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
H	-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
F	-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
I	-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
NO <sub>2</sub>	-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
CN	-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
CH <sub>3</sub>	-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
OCH <sub>3</sub>	-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
CF <sub>3</sub>	-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
OCHF <sub>2</sub>	-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
OCF <sub>3</sub>	-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
H	-	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
F	-	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	-	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>

$R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	$R^5$	$R^6$
Br	-	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
I	-	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
$NO_2$	-	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
CN	-	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
$CH_3$	-	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
$OCH_3$	-	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
$CF_3$	-	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
$OCHF_2$	-	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
$OCF_3$	-	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
$SO_2CH_3$	-	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
H	-	$OCH_3$	
F	-	$OCH_3$	
Cl	-	$OCH_3$	
Br	-	$OCH_3$	
I	-	$OCH_3$	
$NO_2$	-	$OCH_3$	
CN	-	$OCH_3$	
$CH_3$	-	$OCH_3$	
$OCH_3$	-	$OCH_3$	

$R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	$R^5$	$R^6$
$CF_3$	-	$OCH_3$	
$OCHF_2$	-	$OCH_3$	
$OCF_3$	-	$OCH_3$	
$SO_2CH_3$	-	$OCH_3$	
H	(3-) Cl	$CF_3$	$CH_3$
F	(3-) Cl	$CH_3$	$CH_3$
Cl	(3-) Cl	$OCH_3$	$CH_3$
Br	(3-) Cl	Br	
Cl	(3-) Cl	$CF_3$	$CH_3$
$NO_2$	(3-) Cl	$CH_3$	$CH_3$
Cl	(3-) Cl	$SCH_3$	$CH_3$
$CH_3$	(3-) Cl	Cl	$CH_3$
$OCH_3$	(3-) Cl	$OCH_3$	$CH_3$
$CF_3$	(3-) Cl	$CF_3$	$CH_3$
$OCHF_2$	(3-) Cl	$CH_3$	$CH_3$
$OCF_3$	(3-) Cl	$CH_3$	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(3-) Cl	$OCH_3$	$CH_3$

## Gruppe 2

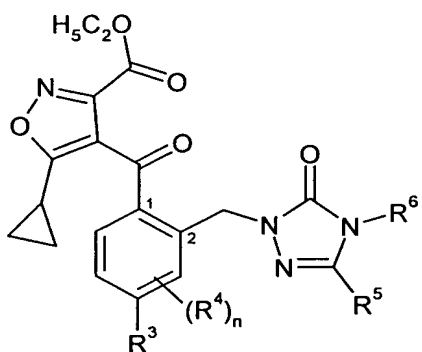


(IA-2)

$R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die für Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5

## Gruppe 3

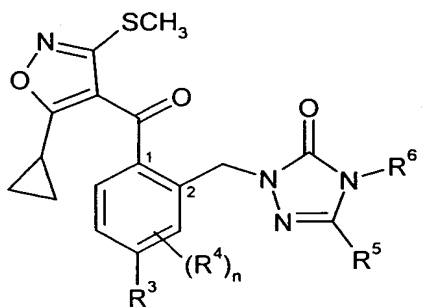


(IA-3)

$R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die für Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

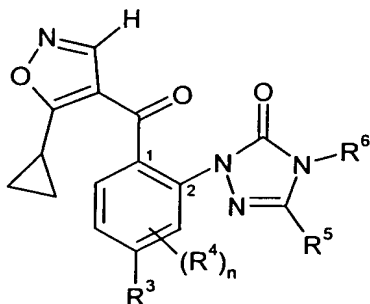
10

## Gruppe 4



(IA-4)

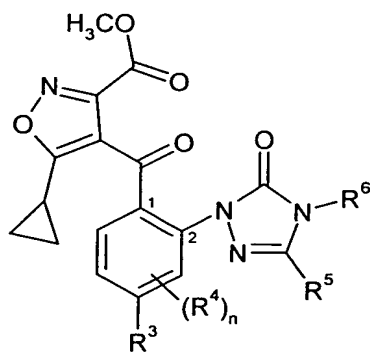
$R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die für Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 5

(IA-5)

$R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die für Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

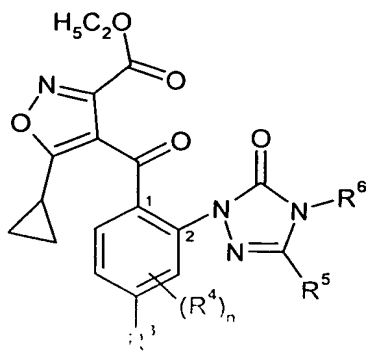
5

Gruppe 6

(IA-6)

$R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die für Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

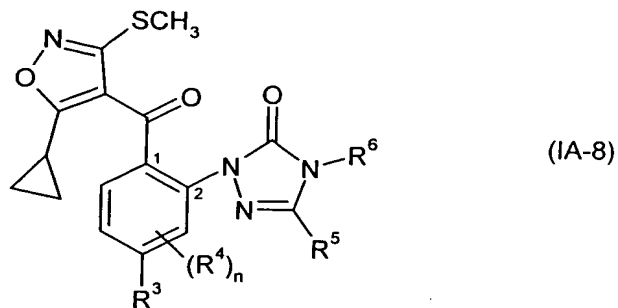
10

Gruppe 7

(IA-7)

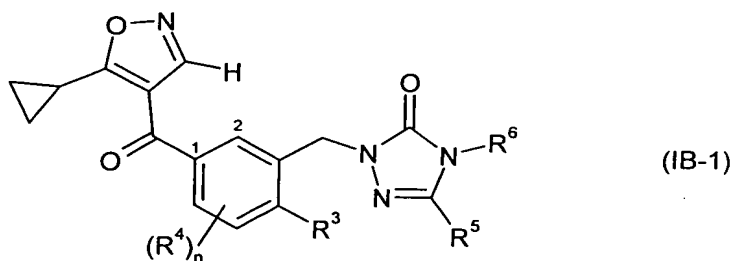
$R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die für Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

### Gruppe 8



$R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die für Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

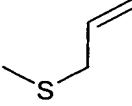
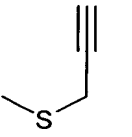
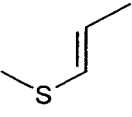
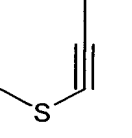
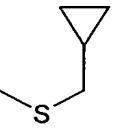
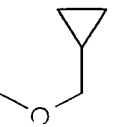
### Gruppe 9

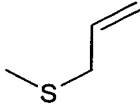
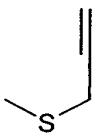
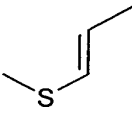
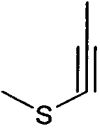
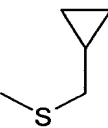



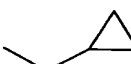
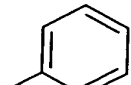
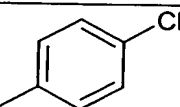
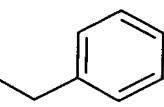
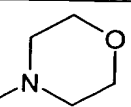
$R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die in der nachstehenden Tabelle angegebenen Bedeutungen:

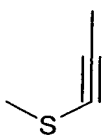
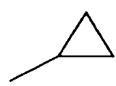
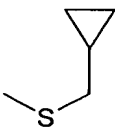
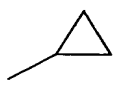

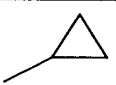

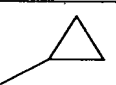
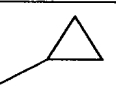

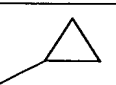

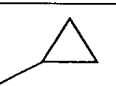
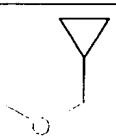
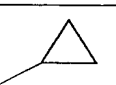
$R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	$R^5$	$R^6$
Cl	(2-) Cl	$CF_3$	$CH_3$
Cl	(2-) Cl	$SCH_3$	$CH_3$
Cl	(2-) Cl	$SC_2H_5$	$CH_3$
Cl	(2-) Cl	$SC_3H_7$	$CH_3$

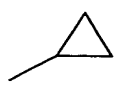
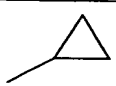
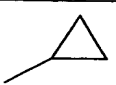
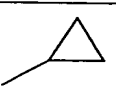
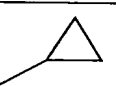

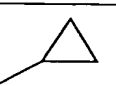

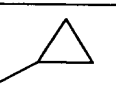
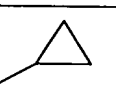
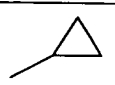
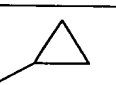

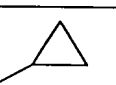
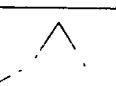


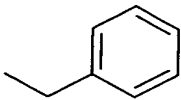
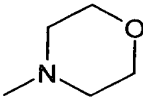

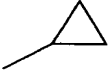
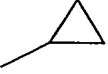
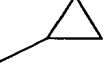
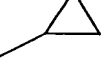
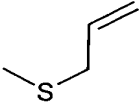
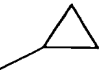
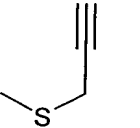

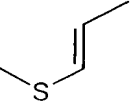
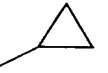
R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
Cl	(2-) Cl	SC <sub>3</sub> H <sub>7-i</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	SCH=C=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	SCH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	OC <sub>3</sub> H <sub>7-i</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>

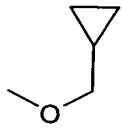

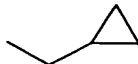
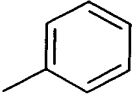
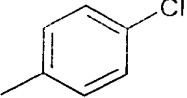
R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	SC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	SC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	SCH=C=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	SCH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

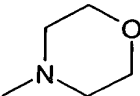
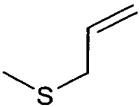
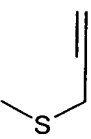
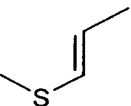
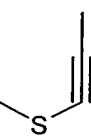
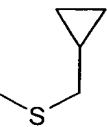
$R^3$	(Position-) ( $R^4$ ) <sub>n</sub>	$R^5$	$R^6$
Cl	(2-) Cl	H	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -i	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -s	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	CH=CHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	Cl	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	Br	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl	SCH=C=CH <sub>2</sub>	
Cl	(2-) Cl	SCH <sub>2</sub> CN	
Cl	(2-) Cl	SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	
Cl	(2-) Cl	OCH <sub>3</sub>	
Cl	(2-) Cl	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
Cl	(2-) Cl	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
Cl	(2-) Cl	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	
Cl	(2-) Cl	OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
Cl	(2-) Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
Cl	(2-) Cl		

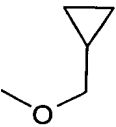

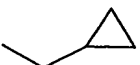
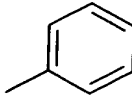
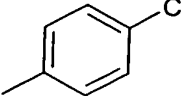
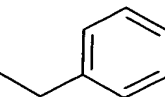
R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
Cl	(2-) Cl	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
Cl	(2-) Cl	H	
Cl	(2-) Cl	CH <sub>3</sub>	
Cl	(2-) Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
Cl	(2-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
Cl	(2-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	
Cl	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
Cl	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -i	
Cl	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -s	
Cl	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t	
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl	CH=CHCH <sub>3</sub>	

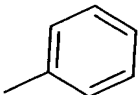

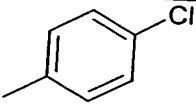
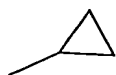
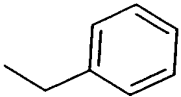

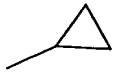
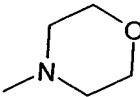
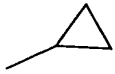



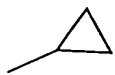
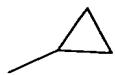

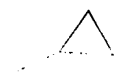
R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	CF <sub>3</sub>	
Cl	(2-) Cl	SCH <sub>3</sub>	
Cl	(2-) Cl	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
Cl	(2-) Cl	SC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
Cl	(2-) Cl	SC <sub>3</sub> H <sub>7-i</sub>	
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl		

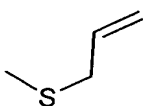
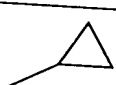
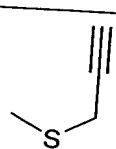
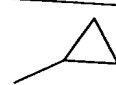
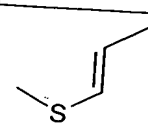
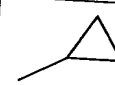
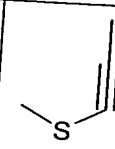

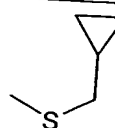





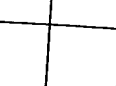
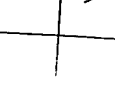
R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -i	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -s	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH=CHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>

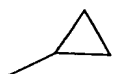
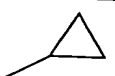
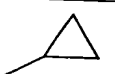
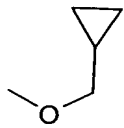
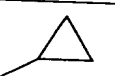






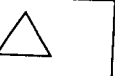
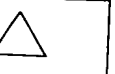
R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	Cl	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	Br	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH=C=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>


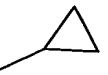


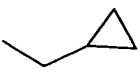


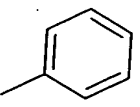

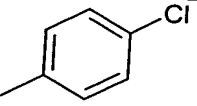

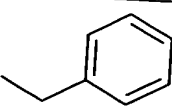

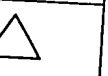
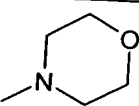
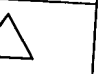
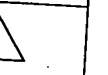
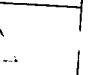


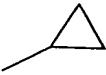


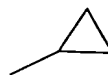
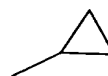
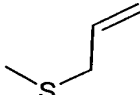

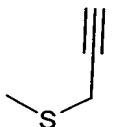

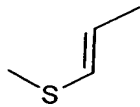
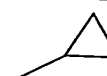
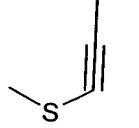

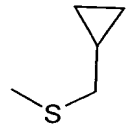


R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	H	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -i	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -s	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	CH=CHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		CH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>

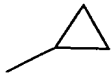
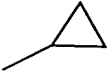
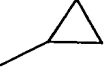
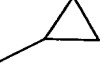
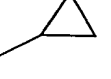



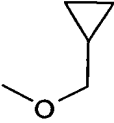




R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl	Cl	
Cl	(2-) Cl	Br	
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	CF <sub>3</sub>	
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	SCH <sub>3</sub>	
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	SC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	SC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	

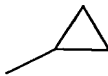
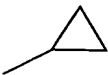

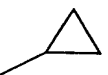

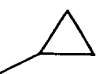



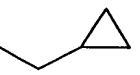


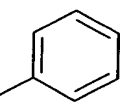

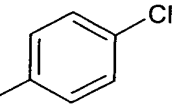
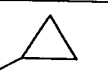
$R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	$R^5$	$R^6$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl		
$SO_2CH_3$	(2-) Cl		
$SO_2CH_3$	(2-) Cl		
$SO_2CH_3$	(2-) Cl		
$SO_2CH_3$	(2-) Cl		
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$SCH=C=CH_2$	
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$SCH_2CN$	
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$SCH_2CH_2CN$	
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$OCH_3$	
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$OC_2H_5$	
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$OC_3H_7$	

$R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	$R^5$	$R^6$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$OC_3H_7-i$	
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$OC_4H_9$	
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$OCH_2CF_3$	
$SO_2CH_3$	(2-) Cl		
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$OC_6H_5$	
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	H	
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$CH_3$	
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$C_2H_5$	
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$C_3H_7$	
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$C_3H_7-i$	
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$C_4H_9$	
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$C_4H_9-i$	

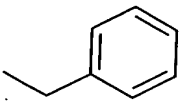


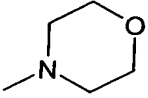



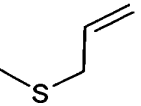
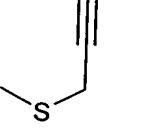
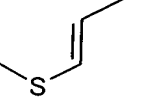
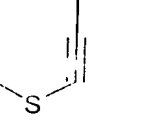
R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -s	
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t	
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	CH=CHCH <sub>3</sub>	
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	Cl	
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	Br	

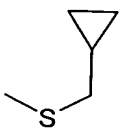
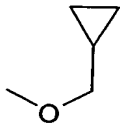

$R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	$R^5$	$R^6$
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$CF_3$	
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$SCH_3$	
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$SC_2H_5$	
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$SC_3H_7$	
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$SC_3H_7-i$	
Cl	(2-) $SO_2CH_3$		
Cl	(2-) $SO_2CH_3$		
Cl	(2-) $SO_2CH_3$		
Cl	(2-) $SO_2CH_3$		
Cl	(2-) $SO_2CH_3$		
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$SCH=C=CH_2$	

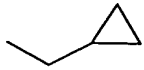
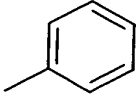
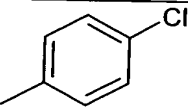
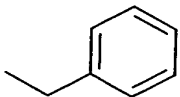
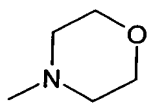
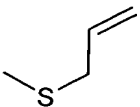
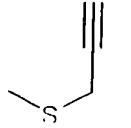
$R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	$R^5$	$R^6$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{SCH}_2\text{CN}$	
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{CN}$	
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{OCH}_3$	
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{OC}_2\text{H}_5$	
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{OC}_3\text{H}_7$	
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{OC}_3\text{H}_7\text{-i}$	
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{OC}_4\text{H}_9$	
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CF}_3$	
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$		
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{OC}_6\text{H}_5$	
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	H	
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	

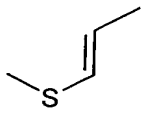
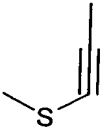
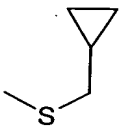
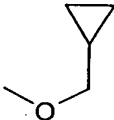
$R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	$R^5$	$R^6$
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$C_2H_5$	
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$C_3H_7$	
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$C_3H_7-i$	
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$C_4H_9$	
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$C_4H_9-i$	
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$C_4H_9-s$	
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$C_4H_9-t$	
Cl	(2-) $SO_2CH_3$		
Cl	(2-) $SO_2CH_3$		
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$CH=CHCH_3$	
Cl	(2-) $SO_2CH_3$		
Cl	(2-) $SO_2CH_3$		


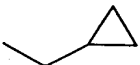
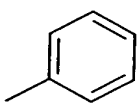
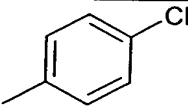
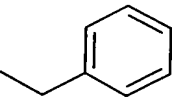
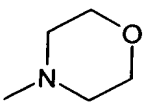


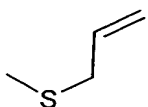
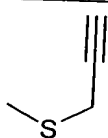
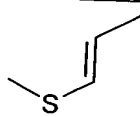
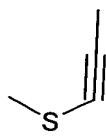
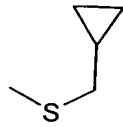
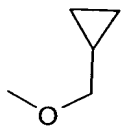
$R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	$R^5$	$R^6$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$		
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$		
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	Cl	
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	Br	
Cl	(2-) Cl	$\text{CF}_3$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) Cl	$\text{SCH}_3$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) Cl	$\text{SC}_2\text{H}_5$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) Cl	$\text{SC}_3\text{H}_7$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) Cl	$\text{SC}_3\text{H}_7\text{-i}$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$\text{N}(\text{CH}_3)_2$


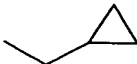
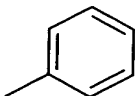
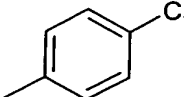
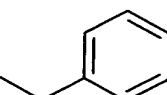
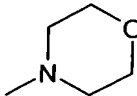
R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
Cl	(2-) Cl		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	SCH=C=CH <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	SCH <sub>2</sub> CN	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	OCH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -i	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -s	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) Cl		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

$R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	$R^5$	$R^6$
Cl	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	$CH=CHCH_3$	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	$N(CH_3)_2$	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	Cl	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	Br	$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$CF_3$	$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$SCH_3$	$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$SC_2H_5$	$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$SC_3H_7$	$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$SC_3H_7-i$	$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$

R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	SCH=C=CH <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	SCH <sub>2</sub> CN	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	OCH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

$R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	$R^5$	$R^6$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$C_4H_9-i$	$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$C_4H_9-s$	$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$C_4H_9-t$	$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$CH=CHCH_3$	$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$N(CH_3)_2$	$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	Cl	$N(CH_3)_2$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	Br	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$CF_3$	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$SCH_3$	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$SC_2H_5$	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$SC_3H_7$	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) $SO_2CH_3$	$SC_3H_7-i$	$N(CH_3)_2$

R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH=C=CH <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>2</sub> CN	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

$R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	$R^5$	$R^6$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{C}_3\text{H}_7$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{C}_3\text{H}_7\text{-i}$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{C}_4\text{H}_9$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{C}_4\text{H}_9\text{-i}$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{C}_4\text{H}_9\text{-s}$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{C}_4\text{H}_9\text{-t}$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$		$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$		$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{CH}=\text{CHCH}_3$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$		$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$		$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$		$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$		$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	Cl	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) $\text{SO}_2\text{CH}_3$	Br	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Cl	(2-) Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_3$
Cl	(2-) Cl	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{OCH}_3$

R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
Cl	(2-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	SCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>
Cl	(2-) Cl	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	(2-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	(2-) Cl	SCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	(2-) Cl	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	(2-) Cl	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	(2-) Cl	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	Cl	OCH <sub>3</sub>
SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(2-) Cl	Br	OCH <sub>3</sub>



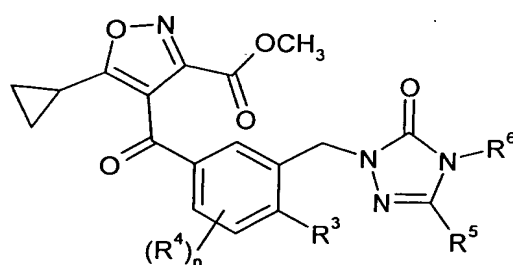
$R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	$R^5$	$R^6$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$CH_3$	$OCH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$C_2H_5$	$OCH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$C_3H_7$	$OCH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$SCH_3$	$OCH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$SC_2H_5$	$OCH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$OCH_3$	$OC_2H_5$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$OC_2H_5$	$OC_2H_5$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$CH_3$	$OC_2H_5$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$C_2H_5$	$OC_2H_5$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$C_3H_7$	$OC_2H_5$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$SCH_3$	$OC_2H_5$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$SC_2H_5$	$OC_2H_5$
$SO_2CH_3$	(2-) Cl	$OCH_3$	$OC_2H_5$
$CF_3$	(2-) Cl	Br	$CH_3$
$CF_3$	(2-) Cl	$SCH_3$	$CH_3$
$CF_3$	(2-) Cl	$OCH_3$	$CH_3$
$CF_3$	(2-) Cl	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
$CF_3$	(2-) Cl	$CF_3$	$CH_3$
$CF_3$	(2-) $NO_2$	Br	$CH_3$
$CF_3$	(2-) $NO_2$	$SCH_3$	$CH_3$
$CF_3$	(2-) $NO_2$	$OCH_3$	$CH_3$
$CF_3$	(2-) $NO_2$	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
$CF_3$	(2-) $NO_2$	$CF_3$	$CH_3$
$CF_3$	(2-) $CH_3$	Br	$CH_3$
$CF_3$	(2-) $CH_3$	$SCH_3$	$CH_3$
$CF_3$	(2-) $CH_3$	$OCH_3$	$CH_3$
$CF_3$	(2-) $CH_3$	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
$CF_3$	(2-) $CH_3$	$CF_3$	$CH_3$

$R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	$R^5$	$R^6$
$CF_3$	(2-) $OCH_3$	Br	$CH_3$
$CF_3$	(2-) $OCH_3$	$SCH_3$	$CH_3$
$CF_3$	(2-) $OCH_3$	$OCH_3$	$CH_3$
$CF_3$	(2-) $OCH_3$	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
$CF_3$	(2-) $OCH_3$	$CF_3$	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) $NO_2$	Br	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) $NO_2$	$SCH_3$	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) $NO_2$	$OCH_3$	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) $NO_2$	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) $NO_2$	$CF_3$	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) $CF_3$	Br	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) $CF_3$	$SCH_3$	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) $CF_3$	$OCH_3$	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) $CF_3$	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) $CF_3$	$CF_3$	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) $SO_2CH_3$	Br	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) $SO_2CH_3$	$SCH_3$	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) $SO_2CH_3$	$OCH_3$	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) $SO_2CH_3$	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
$SO_2CH_3$	(2-) $SO_2CH_3$	$CF_3$	$CH_3$
CN	(2-) Cl	Br	$CH_3$
CN	(2-) Cl	$SCH_3$	$CH_3$
CN	(2-) Cl	$OCH_3$	$CH_3$
CN	(2-) Cl	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
CN	(2-) Cl	$CF_3$	$CH_3$
CN	(2-) $NO_2$	Br	$CH_3$
CN	(2-) $NO_2$	$SCH_3$	$CH_3$
CN	(2-) $NO_2$	$OCH_3$	$CH_3$

R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
CN	(2-) NO <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
CN	(2-) NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
CN	(2-) CF <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>
CN	(2-) CF <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
CN	(2-) CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
CN	(2-) CF <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
CN	(2-) CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
CN	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>
CN	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
CN	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
CN	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
CN	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) NO <sub>2</sub>	Br	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) NO <sub>2</sub>	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) NO <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) NO <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) CF <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) CF <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) CF <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Br	(2-) CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>

$R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	$R^5$	$R^6$
Br	(2-) $CH_3$	$SCH_3$	$CH_3$
Br	(2-) $CH_3$	$OCH_3$	$CH_3$
Br	(2-) $CH_3$	$N(CH_3)_2$	$CH_3$
Br	(2-) $CH_3$	$CF_3$	$CH_3$

### Gruppe 10

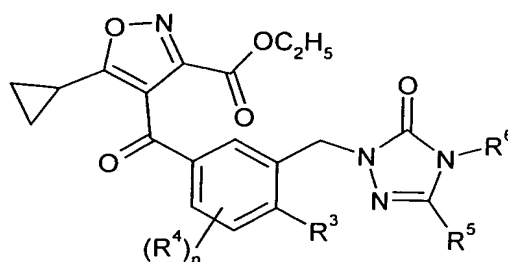


(IB-2)

5

$R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die für Gruppe 9 angegebenen Bedeutungen.

### Gruppe 11

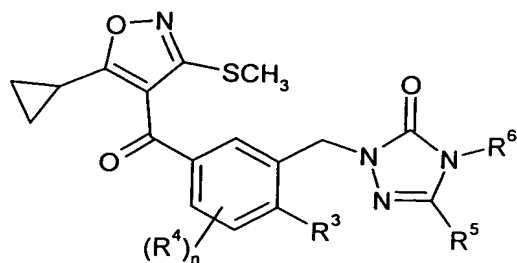


(IB-3)

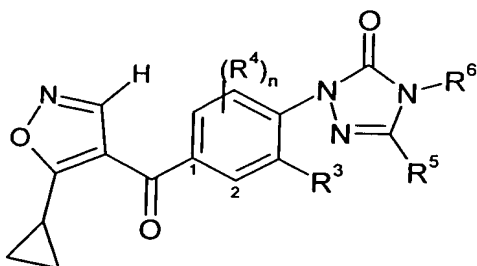
10

$R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die für Gruppe 9 angegebenen Bedeutungen.

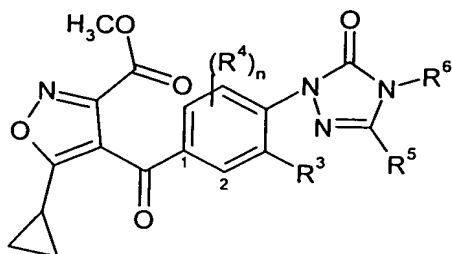
15

Gruppe 12

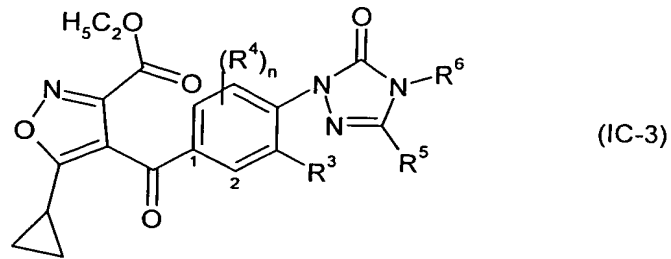
- 5  $R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die für Gruppe 9 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 13

- 10  $R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die für Gruppe 9 angegebenen Bedeutungen.

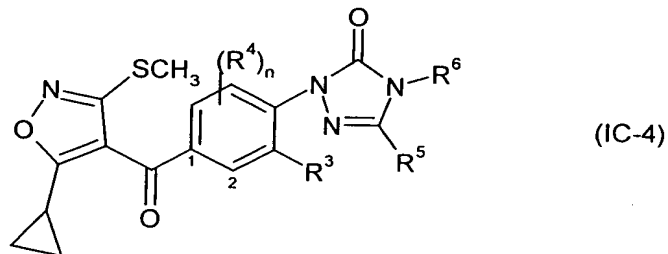
Gruppe 14

- 15  $R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die für Gruppe 9 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 15

$R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die für Gruppe 9 angegebenen Bedeutungen.

5

Gruppe 16

$R^3$ ,  $(R^4)_n$ ,  $R^5$  und  $R^6$  haben hierbei beispielhaft die für Gruppe 9 angegebenen Bedeutungen.

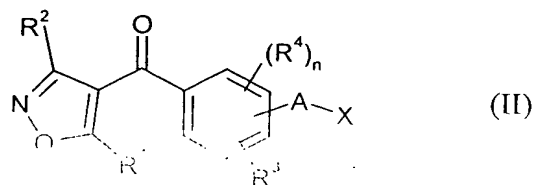
10

Die neuen substituierten Benzoylisoxazole der allgemeinen Formel (I) zeichnen sich durch starke und selektive herbizide Wirksamkeit aus.

Man erhält die neuen substituierten Benzoylisoxazole der allgemeinen Formel (I), wenn man

15

(a) Benzoylisoxazole der allgemeinen Formel (II)



in welcher

$n$ ,  $A$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  und  $R^4$  die oben angegebene Bedeutung haben und

5  $X$  für Halogen steht,

mit Heterocyclen der allgemeinen Formel (III)



10

in welcher

$Z$  die oben angegebene Bedeutung hat,

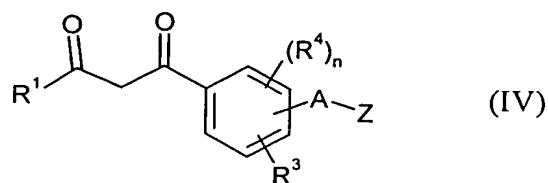
15 gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umgesetzt,

oder wenn man

- für den Fall, daß  $R^2$  für Wasserstoff steht -

20

(b) Benzoylketone der allgemeinen Formel (IV)



25

in welcher

$n$ ,  $A$ ,  $R^1$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  und  $Z$  die oben angegebene Bedeutung haben,

mit einem Orthoameisensäureester oder einem N,N-Dimethyl-formamid-acetal

und anschließend mit Hydroxylamin oder einem Säureaddukt hiervon

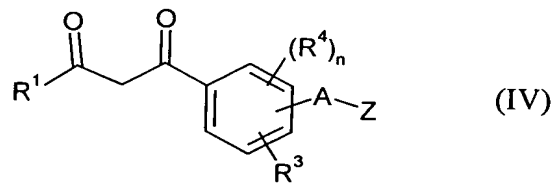
5 gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umsetzt,

oder wenn man

- für den Fall, daß  $R^2$  für gegebenenfalls substituiertes Alkoxycarbonyl steht -

10

(c) Benzoylketone der allgemeinen Formel (IV)



15

in welcher

$n$ ,  $A$ ,  $R^1$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  und  $Z$  die oben angegebene Bedeutung haben,

mit einem Cyanoameisensäureester

20

und anschließend mit Hydroxylamin oder einem Säureaddukt hiervon

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umsetzt,

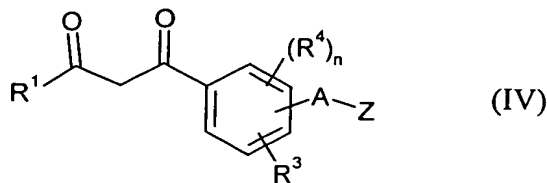
25

oder wenn man

- für den Fall, daß  $R^2$  für Alkylthio steht -



(d) Benzoylketone der allgemeinen Formel (IV)



5 in welcher

$n$ ,  $A$ ,  $R^1$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  und  $Z$  die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Carbondisulfid (Schwefelkohlenstoff) und mit einem Alkylierungsmittel

10

und anschließend mit Hydroxylamin oder einem Säureaddukt hiervon

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umsetzt,

15

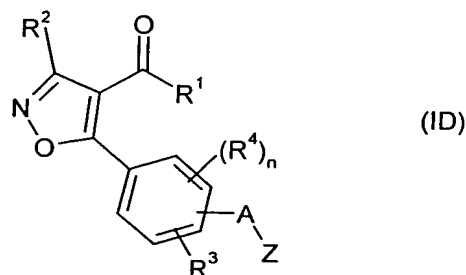
und gegebenenfalls im Anschluß daran an den gemäß Verfahren (a) bis (d) erhaltenen Verbindungen der Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise elektrophile oder nucleophile Substitutionsreaktionen bzw. Oxidations- oder Reduktionsreaktionen durchführt.

20

Die Verbindungen der Formel (I) können nach üblichen Methoden in andere Verbindungen der Formel (I) gemäß obiger Definition umgewandelt werden, beispielsweise durch nucleophile Substitution (z.B.  $R^5$ :  $Cl \rightarrow OC_2H_5$ ,  $SCH_3$ ) oder durch Oxidation (z.B.  $R^5$ :  $CH_2SCH_3 \rightarrow CH_2S(O)CH_3$ ).

25

Bei der Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können in gewissem Umfang auch Verbindungen der allgemeinen Formel (ID) entstehen

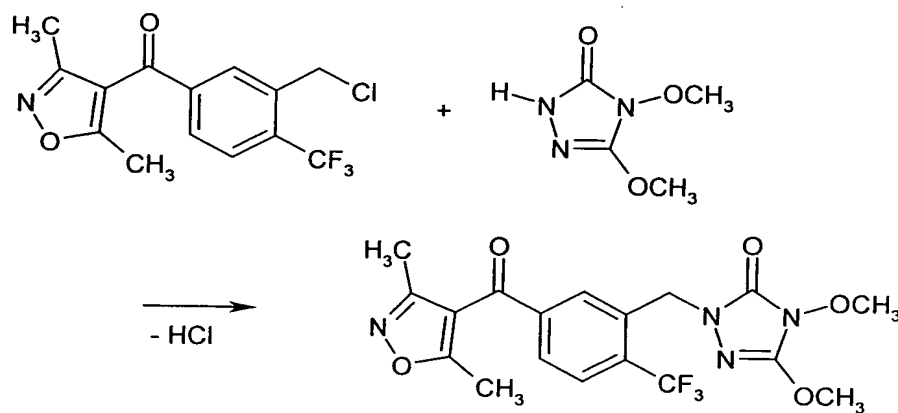


in welcher

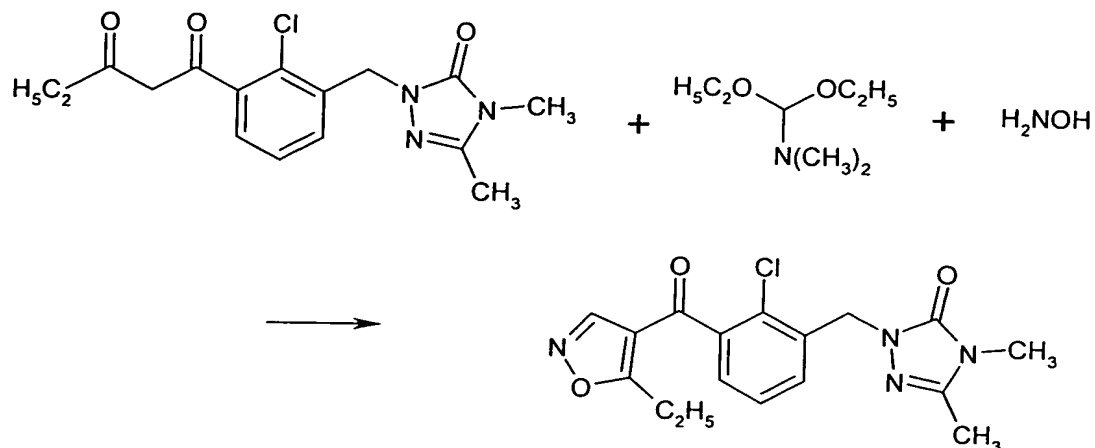
n, A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und Z die oben angegebene Bedeutung haben.

Auch die Verbindungen der allgemeinen Formel (ID) sind als neue Stoffe Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

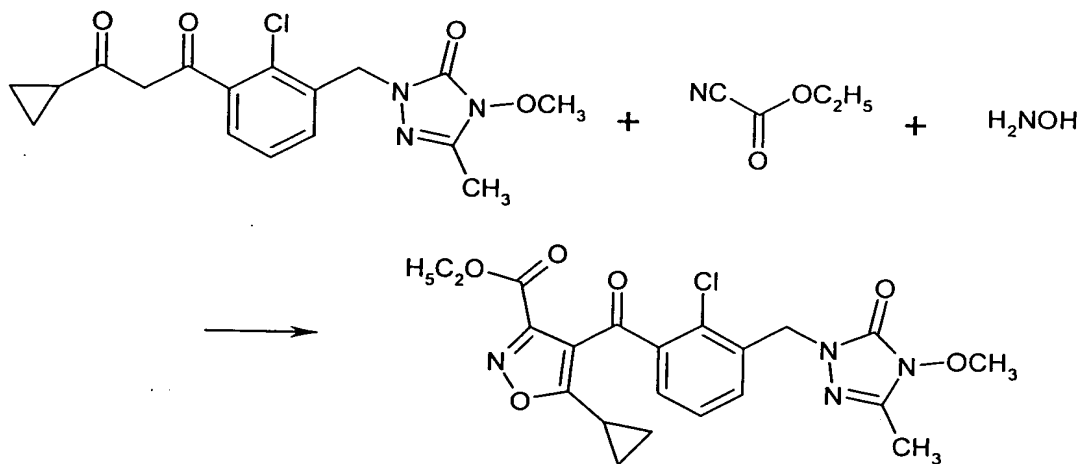
Verwendet man beispielsweise (3-Chlormethyl-4-trifluormethyl-phenyl)-(3,5-dimethyl-isoxazol-4-yl)-methanon und 4,5-Dimethoxy-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



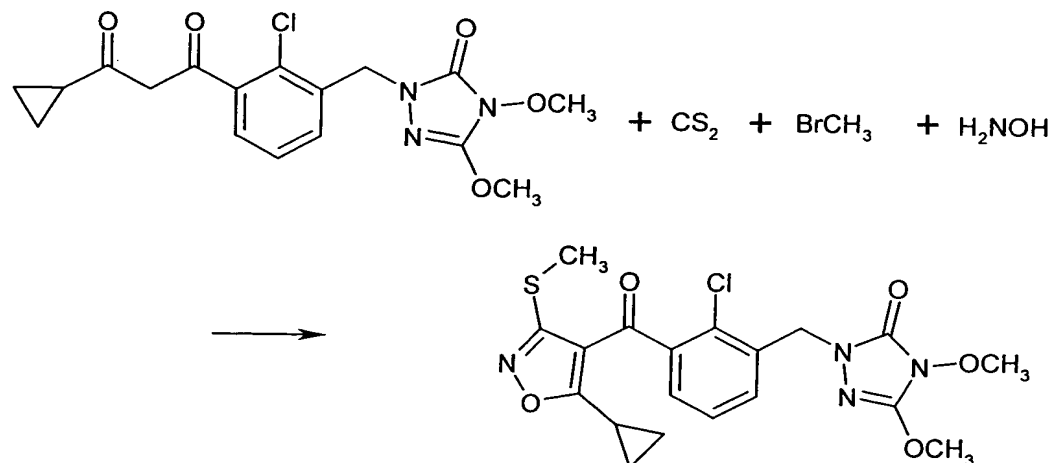
Verwendet man beispielsweise 1-[2-Chlor-3-(3,4-dimethyl-5-oxo-4,5-dihydro-[1,2,4-triazol-1-yl-methyl)-phenyl]-pentan-1,3-dion, N,N-Dimethyl-formamid-diethylacetal und Hydroxylamin als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



Verwendet man beispielsweise 1-[2-Chlor-3-(4-methoxy-3-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1,2,4-triazol-1-yl-methyl)-phenyl]-3-cyclopropyl-propan-1,3-dion, Cyanoameisensäure-ethylester und Hydroxylamin als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



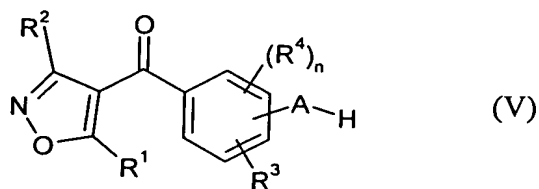
Verwendet man beispielsweise 1-[2-Chlor-3-(4,5-dimethoxy-5-oxo-4,5-dihydro-1,2,4-triazol-1-yl-methyl)-phenyl]-3-cyclopropyl-propan-1,3-dion, Carbondisulfid, Methylbromid und Hydroxylamin als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (d) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Benzoylisoxazole sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (II) haben n, A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für n, A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> angegeben worden sind; X steht vorzugsweise für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, insbesondere für Chlor oder Brom.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (II) sind mit Ausnahme von 4-(2-Brommethyl-benzoyl)-5-cyclopropyl-isoxazol-3-carbonsäure-ethylester (vgl. WO-A-95/31446) noch nicht aus der Literatur bekannt; sie sind unter Ausnahme von 4-(2-Brommethyl-benzoyl)-5-cyclopropyl-isoxazol-3-carbonsäure-ethylester als neue Stoffe auch Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

Man erhält die neuen Benzoylisoxazole der allgemeinen Formel (II), wenn man Benzoylisoxazole der allgemeinen Formel (V)



in welcher

n, A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> die oben angegebene Bedeutung haben,

mit einem Seitenketten-Halogenierungsmittel, wie z.B. N-Brom-succinimid oder N-Chlor-succinimid, im UV-Licht oder in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels, wie z.B. 2,2'-Azo-bis-isobuttersäurenitril, in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Tetrachlormethan, bei Temperaturen zwischen 0°C und 100°C umgesetzt (vgl. WO-A-95/31446; Herstellungsbeispiele).

Die Vorprodukte der allgemeinen Formel (V) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. WO-A-95/31446; Herstellungsbeispiele).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Heterocyclen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (III) hat Z vorzugsweise diejenige Bedeutung, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt für Z angegeben worden ist.

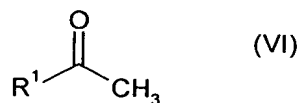
Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (III) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden.

Die bei den erfindungsgemäßen Verfahren (b), (c) und (d) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Benzoylketone sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel

(IV) haben n, A, R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und Z vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für n, A, R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und Z angegeben worden sind.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (IV) sind noch nicht aus der Literatur bekannt; sie sind als neue Stoffe auch Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

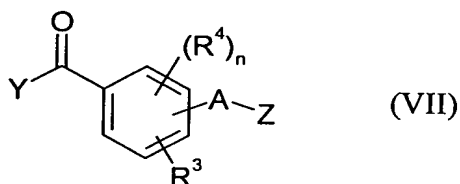
Man erhält die neuen Benzoylketone der allgemeinen Formel (IV), wenn man Ketone der allgemeinen Formel (VI)



in welcher

R<sup>1</sup> die oben angegebene Bedeutung hat,

mit Benzoessäurederivaten der allgemeinen Formel (VII)



in welcher

n, A, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und Z die oben angegebene Bedeutung haben, und

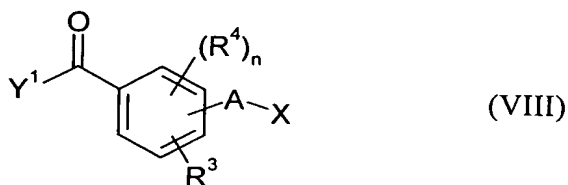
Y für Halogen (insbesondere Fluor, Chlor oder Brom) oder Alkoxy (insbesondere Methoxy oder Ethoxy) steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels, wie z.B. Natriumhydrid, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Tetrahydro-

furan, bei Temperaturen zwischen 0°C und 100°C umgesetzt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die als Vorprodukte benötigten Benzoesäurederivate der allgemeinen Formel (VII) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. DE-A-38 39 480, DE-A-42 39 296, EP-A-597 360, EP-A-609 734, DE-A-43 03 676, EP-A-617 026, DE-A-44 05 614, US-A-5 378 681).

Man erhält die Benzoesäurederivate der allgemeinen Formel (VII), wenn man Halogen(alkyl)benzoesäurederivate der allgemeinen Formel (VIII),



in welcher

n, A, R³ und R⁴ die oben angegebene Bedeutung haben und

X für Halogen (insbesondere Fluor, Chlor oder Brom) steht, und

Y¹ für Alkoxy (insbesondere Methoxy oder Ethoxy) steht,

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (III),



in welcher

Z die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittel, wie z.B. Natriumhydrid, Triethylamin oder Kaliumcarbonat, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Aceton, Acetonitril, N,N-Dimethyl-formamid oder N,N-Dimethyl-acetamid, bei Temperaturen zwischen 50°C und 200°C umgesetzt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die als Vorprodukte benötigten Halogen(alkyl)benzoesäurederivate der Formel (VIII) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP-A-90 369, EP-A-93 488, EP-A-399 732, EP-A-480 641, EP-A-609 798, EP-A-763 524, DE-A-21 26 720, WO-A-93/03722, WO-A-97/38977, US-A-39 78 127, US-A-48 37 333).

Das erfindungsgemäße Verfahren (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) wird unter Verwendung von Orthoameisensäureestern oder N,N-Dimethyl-formamid-acetalen durchgeführt. Diese Verbindungen enthalten vorzugsweise Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere Methyl oder Ethyl. Als Beispiele seien Orthoameisensäure-trimethylester, Orthoameisensäure-triethylester, N,N-Dimethyl-formamid-dimethylacetal und N,N-Dimethyl-formamid-diethylacetal genannt.

Das erfindungsgemäße Verfahren (c) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) wird unter Verwendung von Cyanoameisensäureestern durchgeführt. Diese Verbindungen enthalten vorzugsweise Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere Methyl oder Ethyl. Als Beispiele seien Cyanoameisensäure-methylester und Cyanoameisensäureethylester genannt.

Das erfindungsgemäße Verfahren (d) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) wird unter Verwendung von (Carbondisulfid und) Alkylierungsmitteln durchgeführt. Diese Verbindungen enthalten vorzugsweise Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlen-



stoffatomen, insbesondere Methyl oder Ethyl. Als Beispiele seien Methylchlorid, Methylbromid, Methyliodid, Dimethylsulfat, Ethylchlorid, Ethylbromid, Ethyliodid und Diethylsulfat genannt.

5 Die erfindungsgemäßen Verfahren (b), (c) und (d) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) werden unter Verwendung von Hydroxylamin oder einem Säureaddukt hiervon durchgeführt. Als bevorzugtes Säureaddukt sei Hydroxylamin-Hydrochlorid genannt.

10 Die erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) werden vorzugsweise unter Verwendung von Verdünnungsmitteln durchgeführt. Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) kommen neben Wasser vor allem inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische  
15 oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutylketon; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Butyronitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methyl-formanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid, Alkohole, wie  
20 Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, Ethylenglykolmonomethylether, Ethylenglykolmonoethylether, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Als Reaktionshilfsmittel für die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) kommen im allgemeinen die üblichen anorganischen oder organischen Basen oder  
25 Säureakzeptoren in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetall- -acetate, -amide, -carbonate, -hydrogencarbonate, -hydride, -hydroxide

- oder -alkanolate, wie beispielsweise Natrium-, Kalium- oder Calcium-acetat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-amid, Natrium-, Kalium- oder Calcium-carbonat, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrogencarbonat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrid, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydroxid, Natrium- oder Kalium- -methanolat, -ethanolat, -n- oder -i-propanolat, -n-, -i-, -s- oder -t-butanolat; weiterhin auch basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl-, 4-Methyl-, 2,4-Dimethyl-, 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethylpyridin, 5-Ethyl-2-methyl-pyridin, 4-Dimethylamino-pyridin, N-Methyl-piperidin, 1,4-Diazabicyclo[2,2,2]-octan (DABCO), 1,5-Diazabicyclo[4,3,0]-non-5-en (DBN), oder 1,8-Diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-en (DBU).
- Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.
- Die erfindungsgemäßen Verfahren werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, die erfindungsgemäßen Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.
- Zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren werden die Ausgangsstoffe im allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuß zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im allgemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt. Die Auf-

arbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defoliants, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus, Taraxacum.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita.

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera, Aegilops, Phalaris.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

5

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung, z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen sowie zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

10

15

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeigen starke herbizide Wirksamkeit und ein breites Wirkungsspektrum bei Anwendung auf dem Boden und auf oberirdische Pflanzenteile. Sie eignen sich in gewissem Umfang auch zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen und dikotylen Kulturen, sowohl im Vorauf- als auch im Nachauf-Verfahren.

20

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

25

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumnerzeugenden Mitteln.

30

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-  
5 naphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare  
10 Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Mont-  
morillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse  
15 Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaum-  
20 erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykoether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

25 Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere  
30 Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

5

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

10

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind.

15

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise Acetochlor, Acifluorfen(-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodium), Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Benazolin(-ethyl), Benfuresate, Bensulfuron(-methyl), Bentazon, Benzofenap, Benzoylprop(-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-sodium), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-ethyl), Chlormethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-ethyl), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Cini-don(-ethyl), Cinmethylin, Cinosulfuron, Clethodim, Clodinafop(-propargyl), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron(-methyl), Cloransulam(-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop(-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Desmedipham, Diallylate, Dicamba, Diclofop(-methyl), Diclosulam, Diethatyl(-ethyl), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epoprodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron(-methyl), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop(-P-ethyl), Flamprop(-isopropyl), Flamprop(-isopropyl-L), Flamprop(-methyl), Flazasulfuron, Fluazifop(-P-butyl), Fluazolate, Flucarbazone, Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentyl),

20

25

30

Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-ethyl), Flupoxam, Flupropacil, Flurpysulfuron(-methyl, -sodium), Flurenol(-butyl), Fluridone, Fluroxypyr(-meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-methyl), Fluthiamide, Fomesafen, Glufosinate(-ammonium), Glyphosate(-isopropylammonium), Halosafen, Haloxypfop(-ethoxyethyl), Haloxypfop(-P-methyl),  
 5 Hexazinone, Imazamethabenz(-methyl), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron, Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron,  
 10 Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alpha-)Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron(-methyl), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orben-carb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, Pelargonsäure, Pendimethalin, Pentoxazone, Phenmedipham, Piperophos,  
 15 Pretilachlor, Primisulfuron(-methyl), Procarbazone, Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen(-ethyl), Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyriminobac(-methyl), Pyrithiobac(-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop(-P-ethyl), Quizalofop(-P-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-methyl),  
 20 Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxydim, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron(-methyl), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-methyl), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin und Triflusulfuron.

25

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstruktur-verbesserungsmitteln ist möglich.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder des Formuls durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige

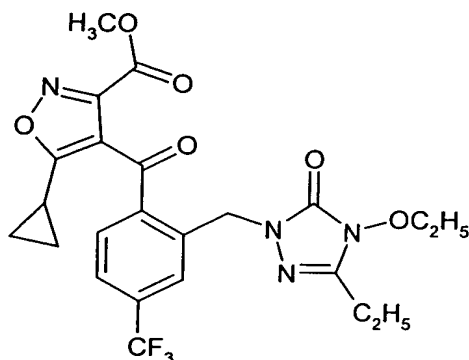
Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

- 5 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

- 10 Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.

- 15 Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.



**Herstellungsbeispiele:****Beispiel 1**

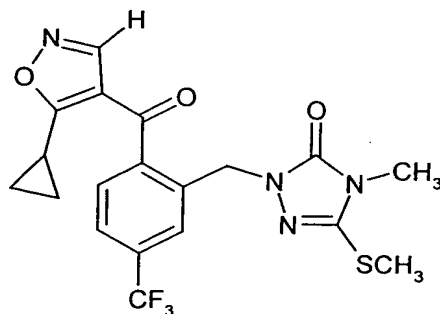
5 (Verfahren (a))

10 Eine Lösung von 1,20 g (33%ig, d.h. 2,8 mMol) 4-(3-Brommethyl-5-trifluormethyl-benzoyl)-5-cyclopropyl-isoxazol-3-carbonsäure-methylester in 10 ml N,N-Dimethylformamid wird bei Raumtemperatur (ca. 20°C) unter Rühren zu einer Mischung aus 0,44 g (2,8 mMol) 4-Ethoxy-5-ethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on, 84 mg (2,8 mMol) Natriumhydrid (75%ig) und 20 ml N,N-Dimethyl-formamid tropfenweise gegeben und die Reaktionsmischung wird 30 Minuten bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird die Mischung mit gesättigter wässriger Natriumchlorid-Lösung auf etwa das doppelte Volumen verdünnt und zweimal mit Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Extraktionslösungen werden mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im Wasserstrahlvakuum eingedampft und der Rückstand durch Säulenchromatografie (Kieselgel, Hexan/Essigsäureethylester, Vol.: 7/3) gereinigt.

20 Man erhält 0,45 g (96% der Theorie bezogen auf 33%iges Edukt) (5-Cyclopropyl-3-methoxycarbonyl-isoxazol-4-yl)-[2-(4-ethoxy-3-ethyl-5-oxo-4,5-dihydro-[1,2,4]-triazol-1-yl-methyl)-4-trifluormethyl-phenyl]-methanon als amorphes Produkt.

Log $\mu$  (bei pH=2,3 bestimmt): 3,56.

## Beispiel 2



(Verfahren (b))

- 5 Eine Mischung aus 1,5 g (36 mMol) 1-Cyclopropyl-3-[2-(4-methyl-3-methylthio-5-oxo-4,5-dihydro-[1,2,4]-triazol-1-yl-methyl)-4-trifluormethyl-phenyl]-propan-1,3-dion, 0,56 g (46 mMol) N,N-Dimethyl-formamid-dimethylacetal und 15 ml Toluol wird 60 Minuten bei 90°C gerührt. Dann wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt, der Rückstand in 15 ml Ethanol aufgenommen und nach Zugabe von 0,25 g (36 mMol)
- 10 Hydroxylamin-Hydrochlorid zwei Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C) gerührt. Nach Einengen im Wasserstrahlvakuum wird der Rückstand mit Methylenchlorid/Wasser geschüttelt, die organische Phase abgetrennt, mit gesättigter wässriger Natriumchlorid-Lösung gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt und der Rückstand durch Säulen-
- 15 chromatografie (Kieselgel, Essigsäureethylester/Hexan, Vol.: 1/1) gereinigt.

Man erhält 0,20 g (13% der Theorie) (5-Cyclopropyl-isoxazol-4-yl)-[2-(4-methyl-3-methylthio-5-oxo-4,5-dihydro-[1,2,4]-triazol-1-yl-methyl)-4-trifluormethyl-phenyl]-methanon als amorphes Produkt.

20 LogP (bei pH=2,3 bestimmt): 2,94.

Analog zu den Beispielen 1 und 2 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Herstellungsverfahren können beispielsweise auch die in der

nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (I) - bzw. der Formeln (IA), (IB) oder (IC) - hergestellt werden.

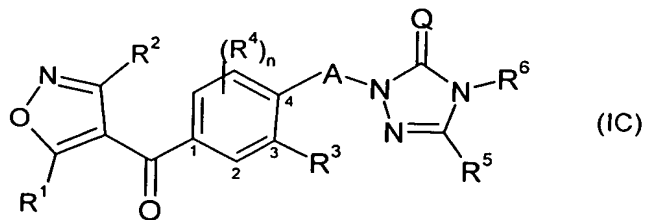
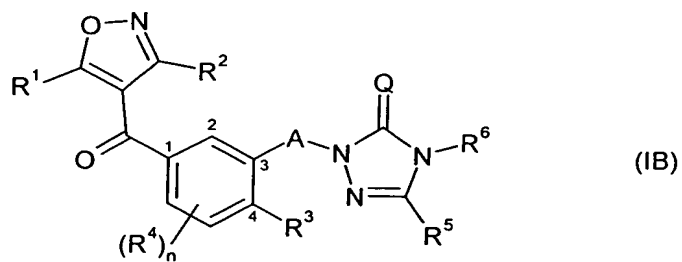
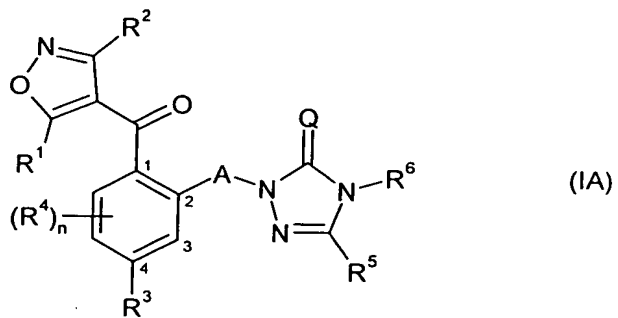

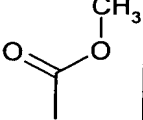

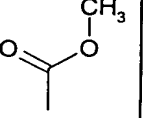

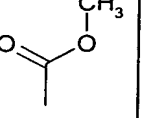

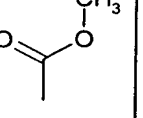

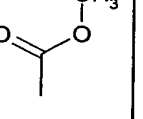


Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formeln (I), (IA), (IB), (IC)

Bsp.- Nr.	A	Q	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	(Formel) Physikal. Daten
3	CH <sub>2</sub>	O			Br	-	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(IA) logP = 3,15 <sup>a)</sup>
4	CH <sub>2</sub>	O			Br	-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(IA) logP = 3,36 <sup>b)</sup>
5	CH <sub>2</sub>	O			Br	-	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	(IA) logP = 3,50 <sup>a)</sup>
6	CH <sub>2</sub>	O			CF <sub>3</sub>	-	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(IA) logP = 3,32 <sup>a)</sup>
7	CH <sub>2</sub>	O			CF <sub>3</sub>	-	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	(IA) logP = 3,22 <sup>a)</sup>

Die Bestimmung der in Tabelle 1 angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

(a) Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1% wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 90% Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit <sup>a)</sup> markiert.

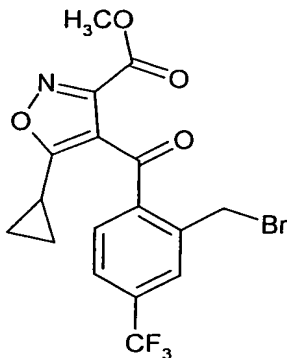
(b) Eluenten für die Bestimmung im neutralen Bereich: 0,01-molare wässrige Phosphatpuffer-Lösung, Acetonitril; linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 90% Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit b) markiert.

5 Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

10 Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

## Ausgangsstoffe der Formel (II):

### Beispiel (II-1)



5

10

Eine Mischung aus 3,0 g (8,5 mMol) 5-Cyclopropyl-4-(2-methyl-4-trifluormethyl-benzoyl)-isoxazol-4-carbonsäure-methylester, 1,5 g (8,5 mMol) N-Brom-succinimid, 0,15 g 2,2'-Azo-bis-isobuttersäurenitril und 45 ml Tetrachlormethan wird zwei Stunden unter Rückfluß erhitzt und nach Abkühlen filtriert. Das Filtrat wird mit Methylenchlorid auf etwa das doppelte Volumen verdünnt, mit 20%iger wässriger Natriumhydrogensulfit-Lösung gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel im Wasserstrahlvakuum sorgfältig abdestilliert.

15

Man erhält 2,5 g (68% der Theorie) 5-Cyclopropyl-4-(2-bromomethyl-4-trifluormethyl-benzoyl)-isoxazol-4-carbonsäure-methylester als amorphes Produkt, welches ohne Reinigung weiter umgesetzt werden kann.

20

Analog Beispiel (II-1) können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der Formel (II) hergestellt werden.

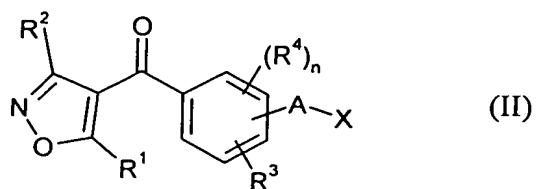

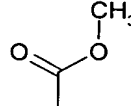

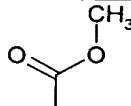

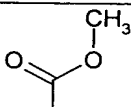

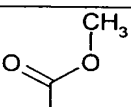

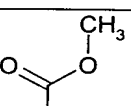

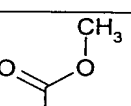


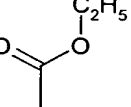

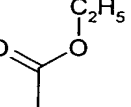

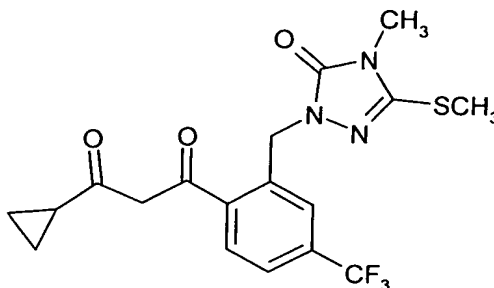


Tabelle 2: Beispiele für die Verbindungen der Formel (II)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	(Position) R <sup>3</sup>	(Position) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position) A-X	Physikal. Daten
II-2			(4-) Br	-	(2-) CH <sub>2</sub> Br	
II-3			(4-) Cl	-	(2-) CH <sub>2</sub> Br	
II-4			(4-) CH <sub>3</sub>	-	(2-) CH <sub>2</sub> Br	
II-5			(4-) CN	-	(2-) CH <sub>2</sub> Br	
II-6			(4-) OCH <sub>3</sub>	-	(2-) CH <sub>2</sub> Br	
II-7			(4-) SCH <sub>3</sub>	-	(2-) CH <sub>2</sub> Br	
II-8			(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-	(2-) CH <sub>2</sub> Br	

II-9			(4-) $\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$	-	(2-) $\text{CH}_2\text{Br}$	
II-10			(4-) $\text{CF}_3$	-	(2-) $\text{CH}_2\text{Br}$	
II-11			(4-) $\text{OCHF}_2$	-	(2-) $\text{CH}_2\text{Br}$	
II-12			(4-) $\text{OCF}_3$	-	(2-) $\text{CH}_2\text{Br}$	
II-13			(4-) $\text{NO}_2$	-	(2-) $\text{CH}_2\text{Br}$	
II-14			(4-) $\text{Cl}$	(2-) $\text{Cl}$	(3-) $\text{CH}_2\text{Br}$	
II-15		H	(4-) $\text{Cl}$	(2-) $\text{Cl}$	(3-) $\text{CH}_2\text{Br}$	
II-16			(4-) $\text{Cl}$	(2-) $\text{Cl}$	(3-) $\text{CH}_2\text{Br}$	
II-17			H	-	(3-) $\text{CH}_2\text{Br}$	
II-18		H	H	-	(3-) $\text{CH}_2\text{Br}$	



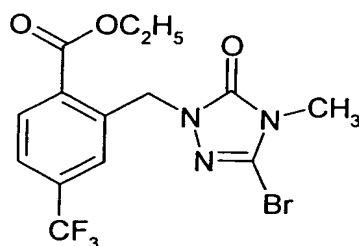
Ausgangsstoffe der Formel (IV):Beispiel (IV-1)

5 Eine Mischung aus 0,94 g (11 mMol) Cyclopropyl-methyl-ke-ton, 0,35 g (11 mMol) Natriumhydrid (75%ig) und 15 ml Tetrahydrofuran wird 30 Minuten bei 20°C gerührt. Dann wird tropfenweise eine Lösung von 2,0 g (5,5 mMol) 4-Methyl-5-methylthio-2-(2-methoxycarbonyl-5-trifluormethyl-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on in 8 ml Tetrahydrofuran dazu zu gegeben und nach Zugabe von 0,2 g Di-  
10 benzo-18-Krone-6 wird die Reaktionsmischung 60 Minuten unter Rückfluß erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur wird mit 100 ml Essigsäureethylester verdünnt, mit gesättigter wässriger Ammoniumchlorid-Lösung geschüttelt, mit Natriumsulfat getrocknet und über Kieselgel filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel im  
15 Wasserstrahlvakuum sorgfältig abdestilliert.

Man erhält 1,5 g (66% der Theorie) 1-Cyclopropyl-3-[4-methyl-3-methylthio-5-oxo-4,5-dihydro-[1,2,4]-triazol-1-yl-methyl)-phenyl]-propan-1,3-dion als amorphes Pro-  
20 dukt, welches ohne Reinigung weiter umgesetzt werden kann.

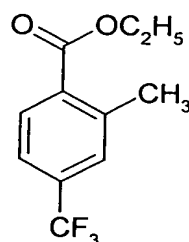
Ausgangsstoffe der Formel (VII):

Beispiel (VII-1)



5

Stufe 1

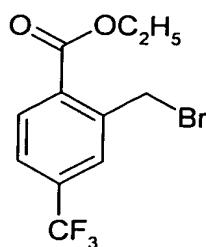


10

10 g (49 mMol) 2-Methyl-4-trifluormethyl-benzoesäure werden in 150 ml Ethanol gelöst und mit 1 ml konz. Schwefelsäure versetzt. Nach 24 Stunden Erhitzen unter Rückfluß wird die Lösung eingeeengt, in Methylenchlorid aufgenommen und mit gesättigter wäßriger Natriumhydrogencarbonat-Lösung extrahiert. Die Methylenchlorid-Phase wird über Natriumsulfat getrocknet und im Wasserstrahlvakuum eingeeengt.

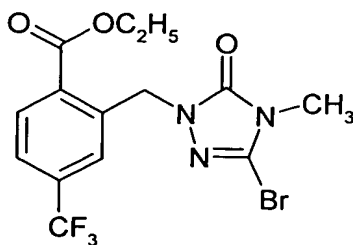
15

Man erhält 9 g (80% der Theorie) 2-Methyl-4-trifluormethyl-benzoesäure-ethylester als amorphen Rückstand.

Stufe 2

9 g (39 mMol) 2-Methyl-4-trifluormethyl-benzoesäure-ethylester werden in 200 ml Tetrachlormethan gelöst und mit 7 g (39 mMol) *N*-Brom-succinimid und 0.1 g Di-benzoylperoxid versetzt. Nach 6 Stunden Erhitzen unter Rückfluß wird das abge-  
5 schiedene Succinimid abfiltriert und das Filtrat im Wasserstrahlvakuum eingeeengt.

Man erhält 12 g eines amorphen Rückstandes, der neben 2-Brommethyl-4-trifluor-  
methyl-benzoesäure-ethylester noch 17 % 2,2-Dibrommethyl-4-trifluormethyl-  
10 benzoessäure-ethylester und 12 % 2-Methyl-4-trifluormethyl-benzoesäure-ethylester  
enthält.

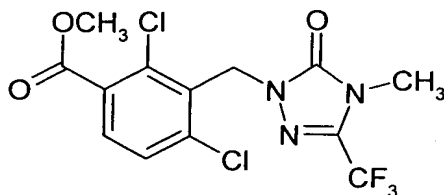
Stufe 3

4 g 2-Brommethyl-4-trifluormethyl-benzoesäure-ethylester (ca. 70%ig) und 2.28 g  
(12,8 mMol) 5-Brom-4-methyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on werden in 150 ml  
Acetonitril gelöst, mit 5.3 g (38,4 mMol) Kaliumcarbonat versetzt und unter kräfti-  
gem Rühren 2 Stunden zum Rückfluß erhitzt. Das Reaktionsgemisch wird in Wasser  
aufgenommen und mit Methylenchlorid mehrfach extrahiert. Die gesammelten  
15 Methylenchlorid-Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet, im Wasserstrahl-  
20 vakuum eingeeengt und chromatographiert.

Man erhält 2 g (38 % der Theorie) 5-Brom-4-methyl-2-(2-ethoxycarbonyl-5-trifluor-methyl-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on als amorphes Produkt.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ ): 5,46 ppm.

## 5 Beispiel (VII-2)



6,7 g (40 mMol) 4-Methyl-5-trifluormethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on werden in 150 ml Acetonitril vorgelegt und mit 11 g (80 mMol) Kaliumcarbonat ver-  
 10 rührt. Nach Erwärmen der Mischung auf 50°C wird dann eine Lösung von 13,1 g (44 mMol) 3-Brommethyl-2,4-dichlor-benzoesäure-methylester in 20 ml Acetonitril unter Rühren tropfenweise dazu gegeben und die Reaktionsmischung wird noch 15  
 15 Stunden unter Rühren zum Rückfluß erhitzt. Anschließend wird im Wasserstrahl-  
 vakuum eingeeengt, der Rückstand in Methylenchlorid aufgenommen, mit 1N-Salz-  
 säure gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird unter  
 vermindertem Druck eingeeengt, der Rückstand mit Petrolether digeriert und das  
 kristallin angefallene Produkt durch Absaugen isoliert.

Man erhält 14,9 g (97% der Theorie) 4-Methyl-5-trifluormethyl-2-(2,6-dichlor-3-  
 20 methoxycarbonyl-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on vom Schmelzpunkt  
 109°C.

Analog zu den Beispielen (VII-1) und (VII-2) können beispielsweise auch die in der  
 nachstehenden Tabelle 3 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (VII)  
 25 hergestellt werden.

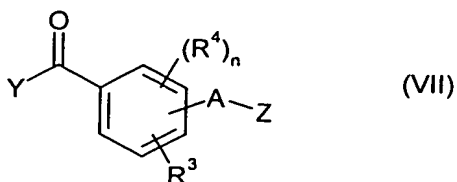
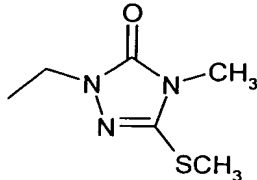
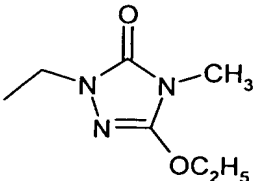
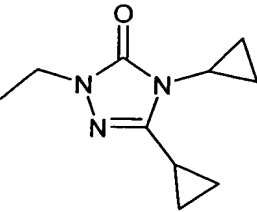
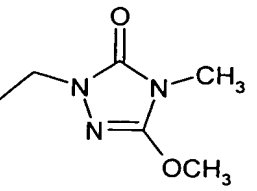
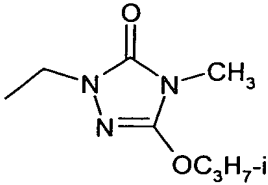
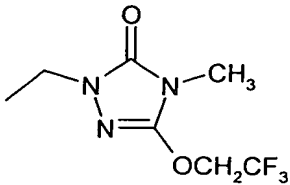
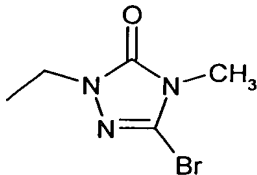
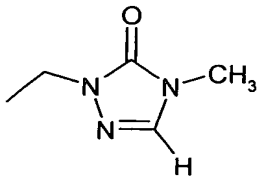
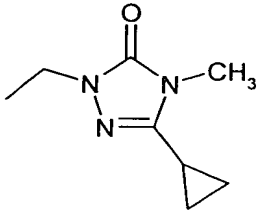
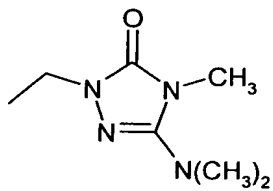
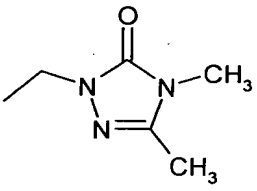
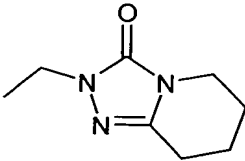
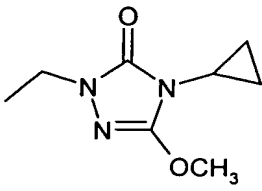
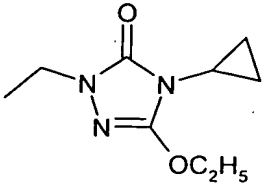
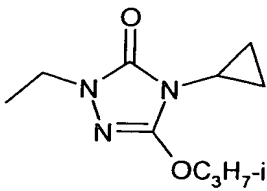
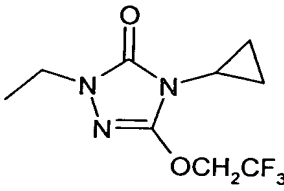
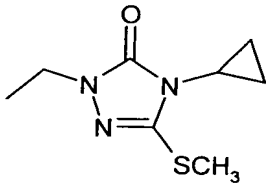
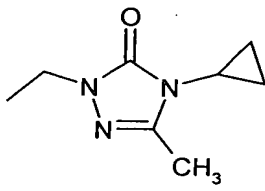
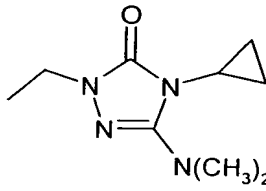


Tabelle 3: Beispiele für die Verbindungen der Formel (VII)

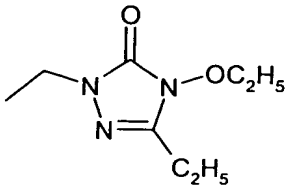
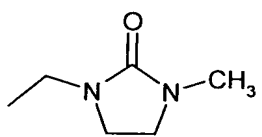
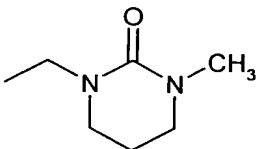
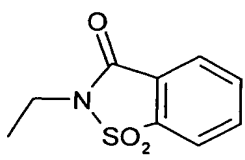
Bsp.- Nr.	(Position-) $R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-3	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 229°C logP = 2,27 <sup>a)</sup>
VII-4	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 120°C logP = 2,38 <sup>a)</sup>
VII-5	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 127°C logP = 2,55 <sup>a)</sup>
VII-6	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 121°C logP = 2,04 <sup>a)</sup>

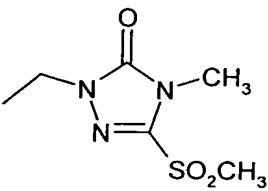
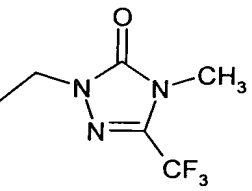
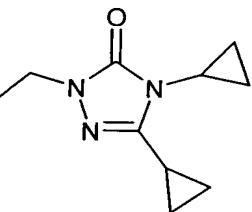
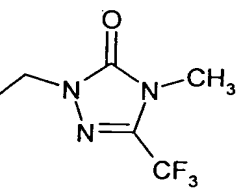
Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-7	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 68°C logP = 2,73 <sup>a)</sup>
VII-8	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 129°C logP = 2,72 <sup>a)</sup>
VII-9	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 164°C logP = 2,18 <sup>a)</sup>
VII-10	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 158°C logP = 1,55 <sup>a)</sup>
VII-11	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 106°C logP = 2,16 <sup>a)</sup>

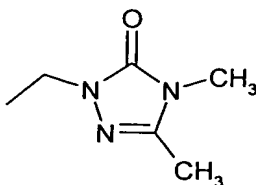
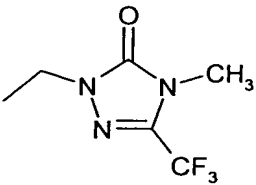
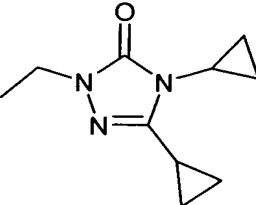
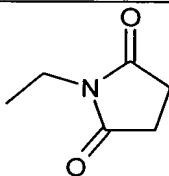
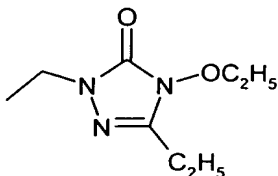
Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-12	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 126°C logP = 2,11 <sup>a)</sup>
VII-13	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 146°C logP = 1,65 <sup>a)</sup>
VII-14	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 178°C logP = 1,86 <sup>a)</sup>
VII-15	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 97°C logP = 2,36 <sup>a)</sup>
VII-16	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 99°C logP = 2,73 <sup>a)</sup>

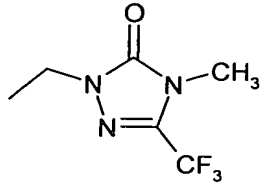
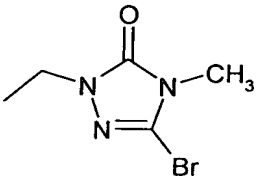
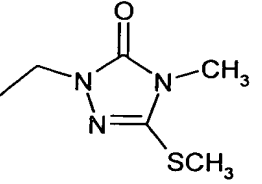
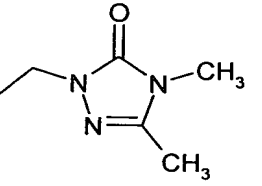
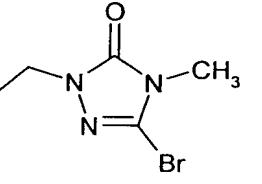
Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-17	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 56°C logP = 3,08 <sup>a)</sup>
VII-18	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 102°C logP = 3,05 <sup>a)</sup>
VII-19	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 131°C logP = 2,70 <sup>a)</sup>
VII-20	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 135°C logP = 1,97 <sup>a)</sup>
VII-21	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 143°C logP = 2,42 <sup>a)</sup>

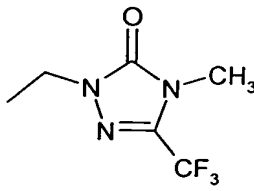
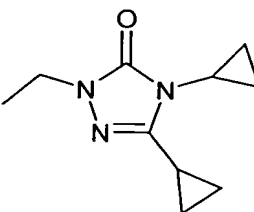
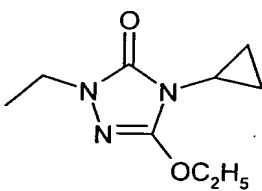
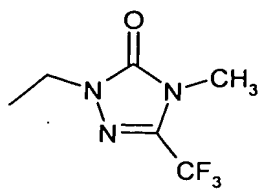
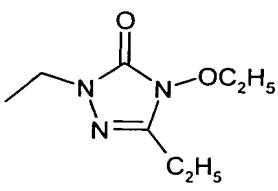


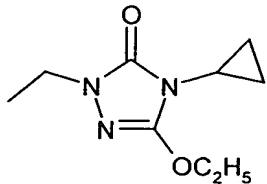
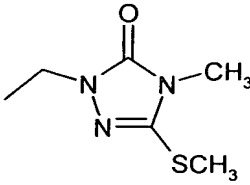
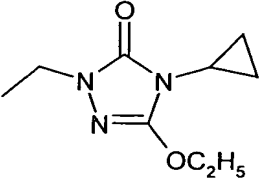
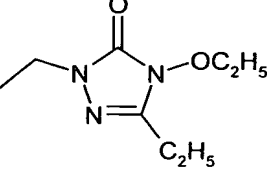
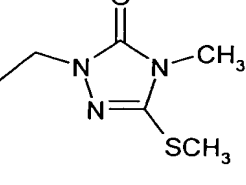
Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-22	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 85°C logP = 2,58 <sup>a)</sup>
VII-23	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	logP = 1,98 <sup>a)</sup>
VII-24	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	logP = 2,07 <sup>a)</sup>
VII-25	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 157°C logP = 2,94 <sup>a)</sup>

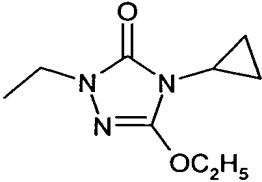
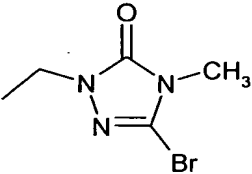
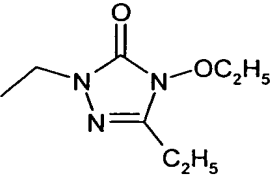
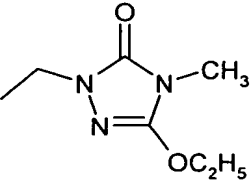
Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-26	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,53 ppm.
VII-27	(4-) NO <sub>2</sub>	-	(3-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,48 ppm.
VII-28	(4-) NO <sub>2</sub>	-	(3-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,30 ppm.
VII-29	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-	(3-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,61 ppm.

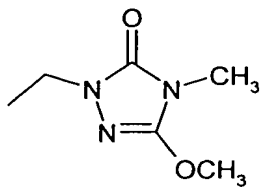
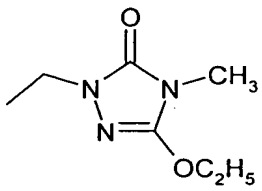
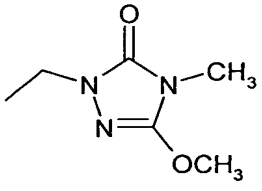
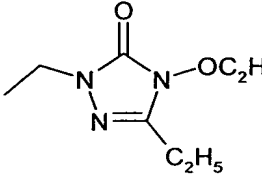
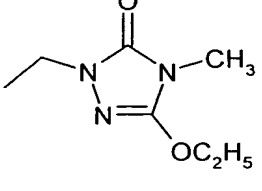
Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-30	(4-) Cl	-	(3-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,08 ppm.
VII-31	(4-) Cl	-	(3-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,17 ppm.
VII-32	(4-) Cl	-	(3-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,00 ppm
VII-33	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 1,53 <sup>a)</sup>
VII-34	(4-) Br	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 3,24 <sup>a)</sup>

Bsp.- Nr.	(Position-) $R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-35	(4-) Br	-	(2-) 	$OC_2H_5$	$\log P = 3,40^a)$
VII-36	(4-) F	-	(3-) 	$OC_2H_5$	$\log P = 2,41^a)$
VII-37	(4-) F	-	(2-) 	$OC_2H_5$	$\log P = 2,45^a)$
VII-38	(4-) Br	-	(3-) 	$OC_2H_5$	$\log P = 2,06^a)$
VII-39	(4-) Br	-	(3-) 	$OC_2H_5$	$\log P = 2,64^a)$

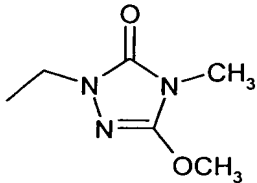
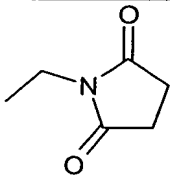
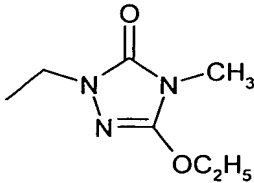
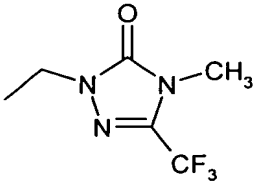
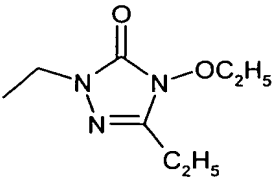
Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-40	(4-) Br	-	(3-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 3,23 <sup>a)</sup>
VII-41	(4-) Br	-	(3-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 3,02 <sup>a)</sup>
VII-42	(4-) Cl	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 3,23 <sup>a)</sup>
VII-43	(4-) Cl	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 3,31 <sup>a)</sup>
VII-44	(4-) Cl	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 3,14 <sup>a)</sup>

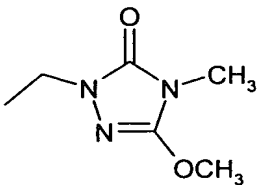
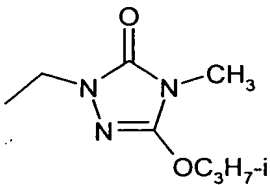
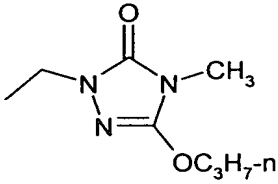
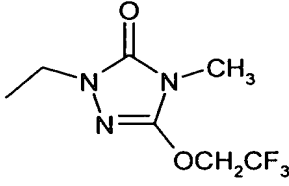
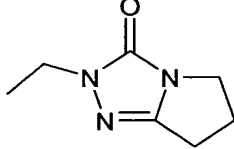
Bsp.- Nr.	(Position-) $R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-45	(4-) $\text{NO}_2$	-	(2-) 	$\text{OC}_2\text{H}_5$	$\log P = 2,42^a$
VII-46	(4-) $\text{NO}_2$	-	(2-) 	$\text{OC}_2\text{H}_5$	$\log P = 2,82^a$
VII-47	(4-) $\text{CF}_3$	-	(2-) 	$\text{OC}_2\text{H}_5$	$\log P = 3,48^a$
VII-48	(4-) $\text{CF}_3$	-	(2-) 	$\text{OC}_2\text{H}_5$	$\log P = 3,38^a$
VII-49	(4-) $\text{CF}_3$	-	(2-) 	$\text{OC}_2\text{H}_5$	$\log P = 3,02^a$

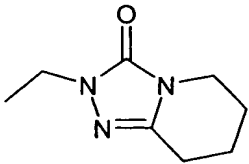
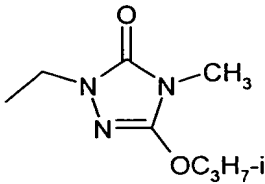
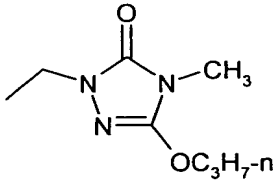
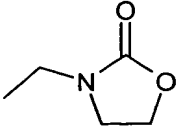
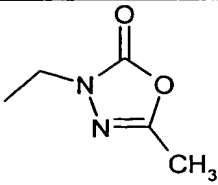
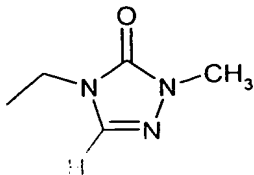
Bsp.- Nr.	(Position-) $R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-50	(4-) $CF_3$	-	(2-) 	$OC_3H_7$	$\log P = 3,91^{a)}$
VII-51	(4-) $OCH_3$	-	(2-) 	$OC_2H_5$	
VII-52	(4-) $OCH_3$	-	(2-) 	$OC_2H_5$	
VII-53	(4-) $CF_3$	-	(2-) 	$OC_2H_5$	$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ , $\delta$ ): 5,37 ppm.

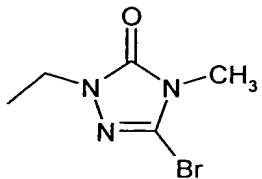
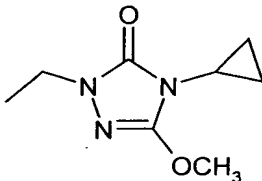
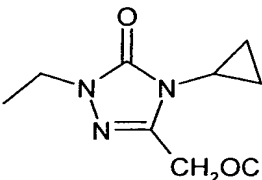
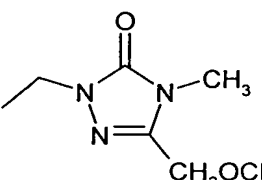
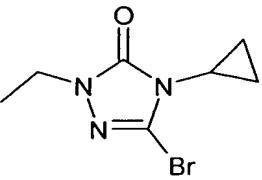
Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-54	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,37 ppm.
VII-55	-	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
VII-56	-	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,37 ppm.
VII-57	-	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,40 ppm.
VII-58	(4-) Br	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,95 <sup>a)</sup>

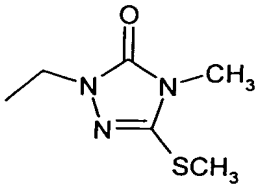
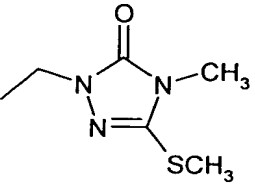
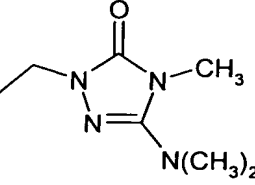
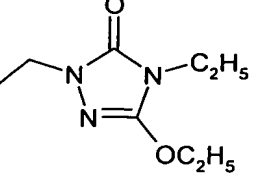
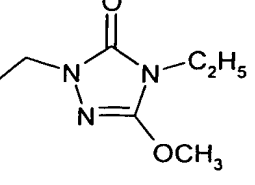


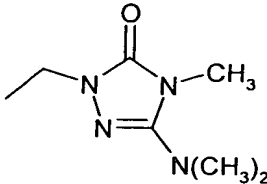
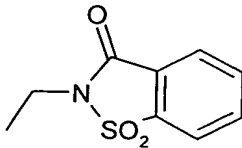
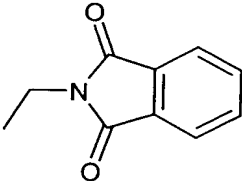
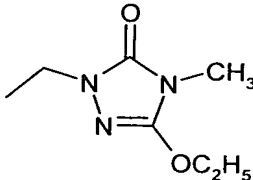
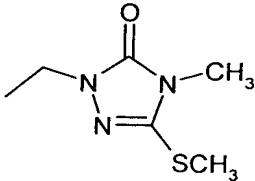
Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-59	(4-) Br	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,31 ppm.
VII-60	(4-) Br	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,44 <sup>a)</sup>
VII-61	(4-) F	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,35 ppm.
VII-62	(4-) F	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,53 ppm.
VII-63	(4-) F	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,40 ppm.

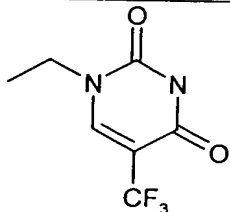
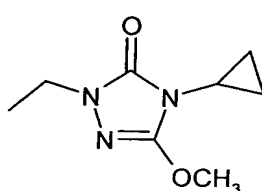
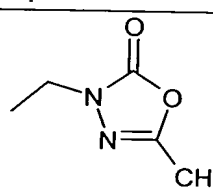
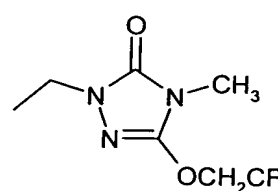
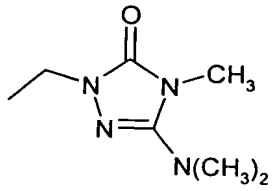
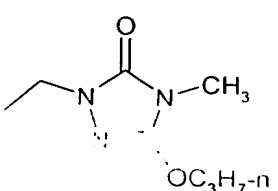
Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-64	(4-) F	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,36 ppm.
VII-65	(4-) Br	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 3,34 <sup>a)</sup>
VII-66	(4-) Br	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 3,38 <sup>a)</sup>
VII-67	(4-) Br	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 3,31 <sup>a)</sup>
VII-68	(4-) Br	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,16 <sup>a)</sup>

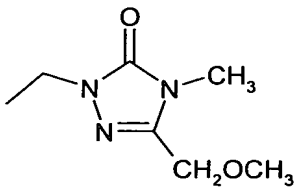
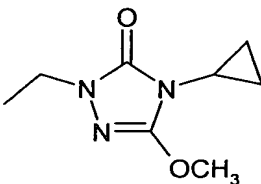
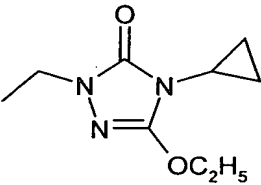
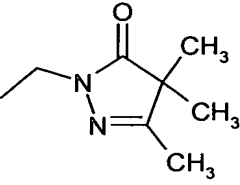
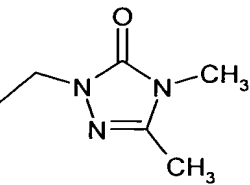
Bsp.- Nr.	(Position-) $R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-69	(4-) Br	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,41 <sup>a)</sup>
VII-70	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 3,51 <sup>a)</sup>
VII-71	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 3,54 <sup>a)</sup>
VII-72	(4-) Br	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,36 <sup>a)</sup>
VII-73	(4-) Br	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,88 <sup>a)</sup>
VII-74	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,68 <sup>a)</sup>

Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-75	(4-) Br	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,80 <sup>a)</sup>
VII-76	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(3-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 3,87 <sup>a)</sup>
VII-77	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,88 <sup>a)</sup>
VII-78	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,60 <sup>a)</sup>
VII-79	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 3,35 <sup>a)</sup>

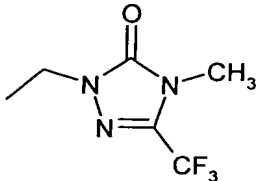
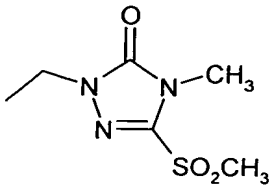
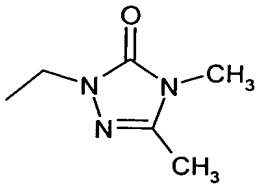
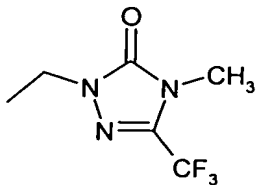
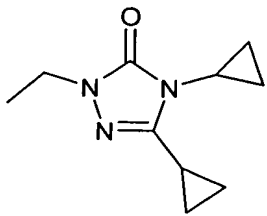
Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-80	(4-) Br	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,86 <sup>a)</sup>
VII-81	(4-) Cl	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,83 <sup>a)</sup>
VII-82	(4-) Br	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,60 <sup>a)</sup>
VII-83	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,36 ppm.
VII-84	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,37 ppm.

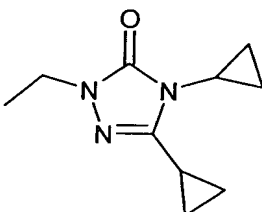
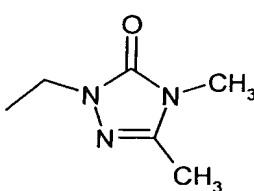
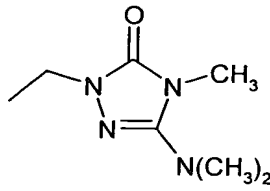
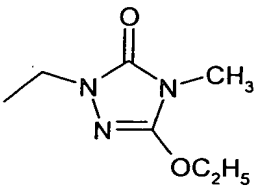
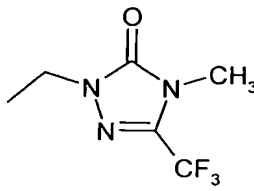
Bsp.- Nr.	(Position-) $R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-85	(4-) $CF_3$	-	(2-) 	$OC_2H_5$	$\log P = 2,79^a$
VII-86	(4-) $CF_3$	-	(2-) 	$OC_2H_5$	$\log P = 3,67^a$
VII-87	(4-) $CF_3$	-	(2-) 	$OC_2H_5$	$\log P = 3,80^a$
VII-88	(3-) $CH_3$	-	(2-) 	$OC_2H_5$	$\log P = 2,54^a$
VII-89	(4-) $SO_2CH_3$	-	(2-) 	$OC_2H_5$	$\log P = 1,82^a$

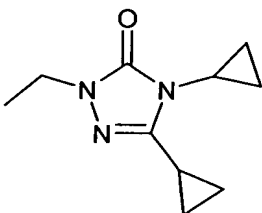
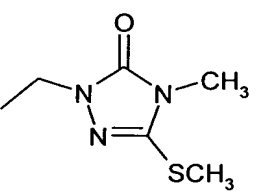
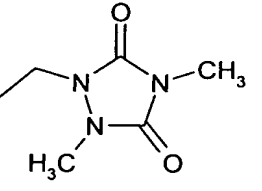
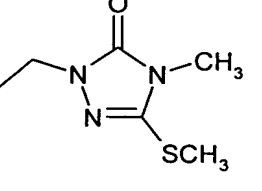
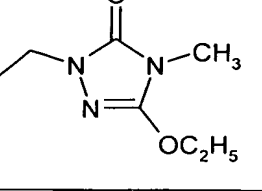
Bsp.- Nr.	(Position-) $R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-90	(4-) $CF_3$	-	 (2-)	$OC_2H_5$	$\log P = 2,93^a)$
VII-91	(4-) $CF_3$	-	 (2-)	$OC_2H_5$	$\log P = 3,08^a)$
VII-92	(4-) $CF_3$	-	 (2-)	$OC_2H_5$	$\log P = 3,04^a)$
VII-93	(4-) $CF_3$	-	 (2-)	$OC_2H_5$	$\log P = 3,45^a)$
VII-94	(4-) F	-	 (2-)	$OC_2H_5$	$\log P = 2,21^a)$
VII-95	(4-) F	-	 (2-)	$OC_2H_5$	$\log P = 2,96^a)$

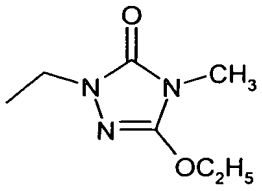
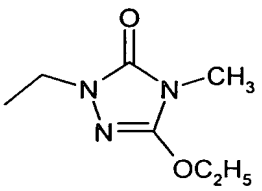
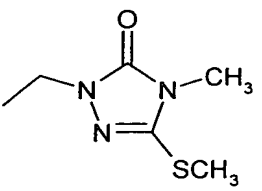
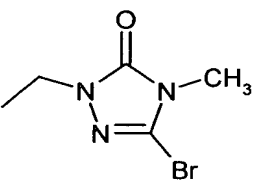
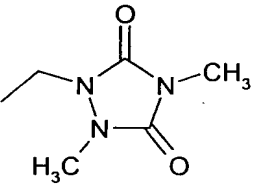
Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII-96	(4-) F	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,05 <sup>a)</sup>
VII-97	(4-) F	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,50 <sup>a)</sup>
VII-98	(4-) F	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,89 <sup>a)</sup>
VII-99	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,91 <sup>a)</sup>
VII- 100	(4-) Cl	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,39 ppm.

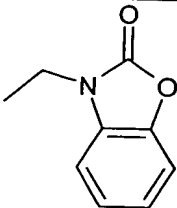
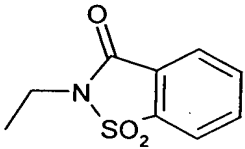
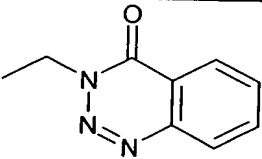


Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII- 101	(4-) Cl	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,50 ppm.
VII- 102	(4-) Cl	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,49 ppm.
VII- 103	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,29 ppm.
VII- 104	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,53 ppm.
VII- 105	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,34 ppm.

Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII- 106	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,39 ppm.
VII- 107	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,43 ppm.
VII- 108	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,40 ppm.
VII- 109	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,38 ppm.
VII- 110	(4-) Br	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,49 ppm.

Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII- 111	-	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,3 ppm.
VII- 112	-	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 5,44 ppm.
VII- 113	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,58 <sup>a)</sup>
VII- 114	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-	(2-) 	OCH <sub>3</sub>	logP = 1,53 <sup>a)</sup>
VII- 115	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-	(2-) 	OCH <sub>3</sub>	logP = 1,59 <sup>a)</sup>

Bsp.- Nr.	(Position-) R <sup>3</sup>	(Position-) (R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII- 116	(4-) I	-	(2-) 	OCH <sub>3</sub>	logP = 2,68 <sup>a)</sup>
VII- 117	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OCH <sub>3</sub>	logP = 2,74 <sup>a)</sup>
VII- 118	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OCH <sub>3</sub>	logP = 2,65 <sup>a)</sup>
VII- 119	(4-) CF <sub>3</sub>	-	(2-) 	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logP = 2,96 <sup>a)</sup>
VII- 120	-	-	(2-) 	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 106°C

Bsp.- Nr.	(Position-) $R^3$	(Position-) $(R^4)_n$	(Position-) -A-Z	Y	Physikal. Daten
VII- 121	(4-) $CF_3$	-	 (2-)	$OCH_3$	$\log P = 3,37^a)$
VII- 122	(4-) $CF_3$	-	 (2-)	$OCH_3$	$\log P = 3,29^a)$
VII- 123	(4-) $CF_3$	-		$OCH_3$	$\log P = 3,26^a)$

Die Bestimmung der in Tabelle 3 angegebenen  $\log P$ -Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

5

(a) Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit a) markiert.

10

(b) Eluenten für die Bestimmung im neutralen Bereich: 0,01-molare wässrige Phosphatpuffer-Lösung, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit b) markiert.

15

Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren  $\log P$ -Werte bekannt sind (Bestimmung der  $\log P$ -Werte anhand der

Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

- 5 Die  $\lambda$ -max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

Anwendungsbeispiele:

Beispiel A

Pre-emergence-Test

5

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15

Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach ca. 24 Stunden wird der Boden so mit der Wirkstoffzubereitung besprüht, daß die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge pro Flächeneinheit ausgebracht wird. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 1000 Liter Wasser pro Hektar die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge ausgebracht wird.

20

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

25

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)  
100 % = totale Vernichtung

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 3 und 4 bei guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais, starke Wirkung gegen Unkräuter.

**Beispiel B**

## Post-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben so, daß die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

20 Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

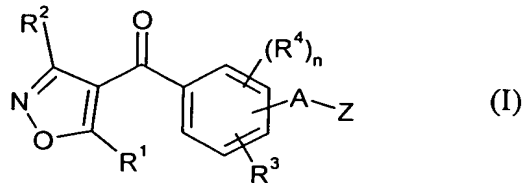
100 % = totale Vernichtung

25 In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 3 und 4 bei guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Weizen, sehr starke Wirkung gegen Unkräuter.



Patentansprüche

1. Benzoylisoxazole der allgemeinen Formel (I),



in welcher

$n$  für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3 steht,

$A$  für eine Einfachbindung oder für Alkandiyl (Alkylen) steht,

$R^1$  für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl oder Cycloalkyl steht,

$R^2$  für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxy-carbonyl oder Alkylthio steht,

$R^3$  für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht,

$R^4$  Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht, und

Z für eine gegebenenfalls substituierte 4- bis 12-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische, heterocyclische Gruppierung steht, welche 1 bis 4 Heteroatome (bis zu 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls - alternativ oder additiv - ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom, oder eine SO-Gruppierung oder eine SO<sub>2</sub>-Gruppierung) enthält, und welche zusätzlich ein bis drei Oxo-Gruppen (C=O) und/oder Thioxo-Gruppen (C=S) als Bestandteile des Heterocyclus enthält.

2. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

A für eine Einfachbindung oder für Alkandiyl (Alkylen) mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

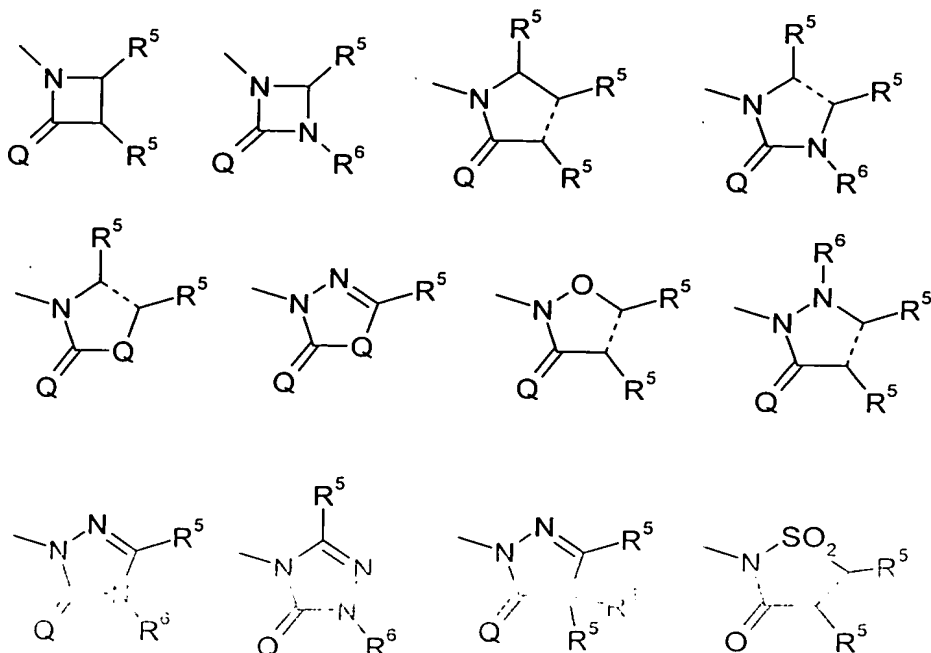
R<sup>1</sup> für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

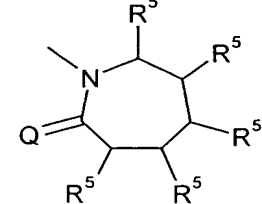
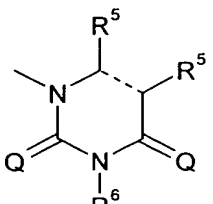
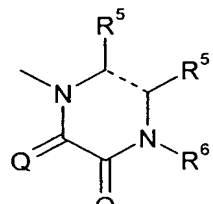
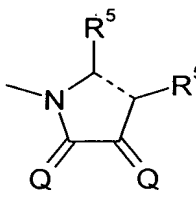
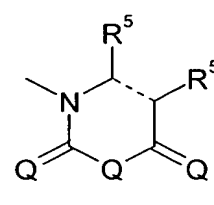
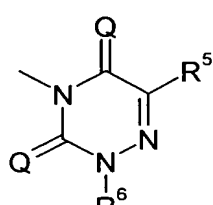
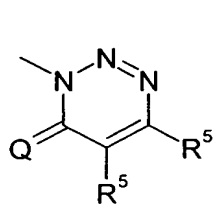
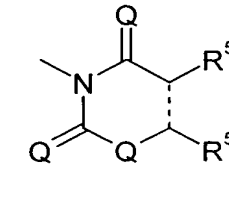
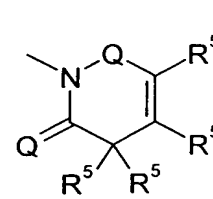
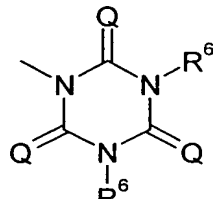
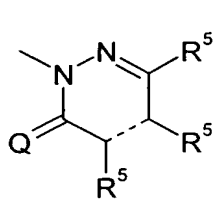
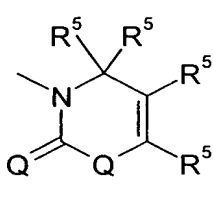
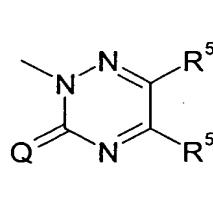
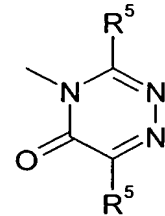
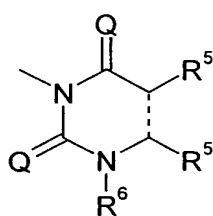
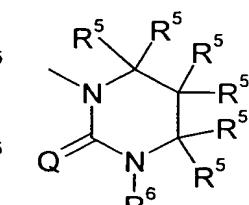
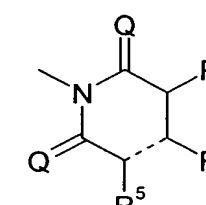
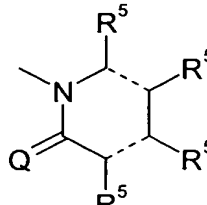
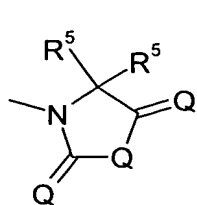
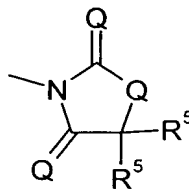
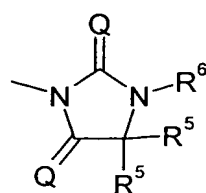
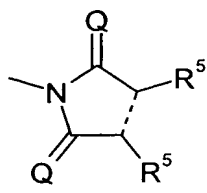
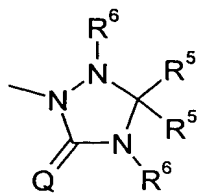
R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy oder Alkoxy-carbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, oder für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylthio mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht.

R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

R<sup>4</sup> für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht, und

Z für eine der nachstehenden heterocyclischen Gruppierungen steht





worin jeweils die gestrichelt gezeichnete Bindung eine Einfachbindung oder eine Doppelbindung ist, und jede heterocyclische Gruppierung vorzugsweise nur zwei Substituenten der Definition R<sup>5</sup> und/oder R<sup>6</sup> trägt,

5

Q für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R<sup>5</sup> für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Alkenylthio oder Alkenylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkynylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkylalkylthio oder Cycloalkylalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Phenyl, Phenyloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino steht, für Pyrrolidino, Piperidino oder Morpholino steht, oder – für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R<sup>5</sup> und R<sup>5</sup> sich an einer Doppelbindung befinden – auch zusammen mit dem benachbarten Rest R<sup>5</sup> für eine Benzogruppierung steht, und

15

20

25

30

5

20

25

30

gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

5

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio steht,

10

15

R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl steht,

20

25

30

R<sup>4</sup> für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-

4. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, daß

5 R<sup>1</sup> für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl steht,

10 R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, oder  
15 für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio steht,

20 R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,

25 R<sup>4</sup> für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,

30 R<sup>5</sup> für Wasserstoff, Hydroxy, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluor-



methyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Fluorethyl, Chlorethyl, Difluorethyl, Dichlorethyl, Fluor-n-propyl, Fluor-i-propyl, Chlor-n-propyl, Chlor-i-propyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Fluorethoxy, Chlorethoxy, Difluorethoxy, Dichlorethoxy, Trifluorethoxy, Trichlorethoxy, Chlorfluorethoxy, Chlordifluorethoxy, Fluordichlorethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Fluorethylthio, Chlorethylthio, Difluorethylthio, Dichlorethylthio, Chlorfluorethylthio, Chlordifluorethylthio, Fluordichlorethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Dimethylamino, Propenylthio, Butenylthio, Propinylthio, Butinylthio, Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Phenyl oder Phenoxy steht, und

R<sup>6</sup> für Amino, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Methylamino, Dimethylamino, Cyclopropyl oder Cyclopropylmethyl steht, oder zusammen mit R<sup>5</sup> für Propan-1,3-diyl (Trimethylen), Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) oder Pentan-1,5-diyl (Pentamethylen) steht.

5. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß

A für Methylen steht.

6. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, daß

Q für Sauerstoff (O) steht.

7. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6, dadurch gekennzeichnet, daß

$R^1$  für Cyclopropyl steht.

5

8. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 7, dadurch gekennzeichnet, daß

$R^2$  für Methoxycarbonyl steht.

10

9. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8, dadurch gekennzeichnet, daß

$R^6$  für Methyl, Dimethylamino oder Cyclopropyl steht.

15

10. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 9, dadurch gekennzeichnet, daß

$R^3$  für Chlor, Brom, Cyano, Trifluormethyl oder Methylsulfonyl steht.

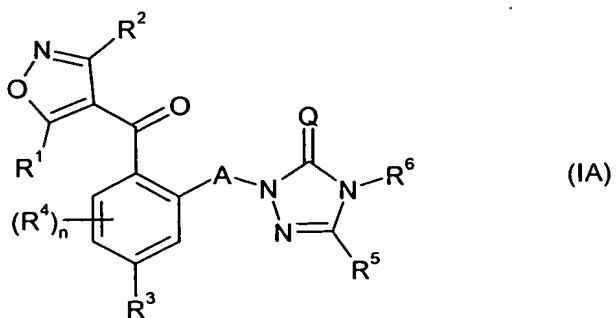
20

11. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 10, dadurch gekennzeichnet, daß

$R^4$  für Wasserstoff, Chlor, Nitro, Methyl, Trifluormethyl oder Methylsulfonyl steht.

25

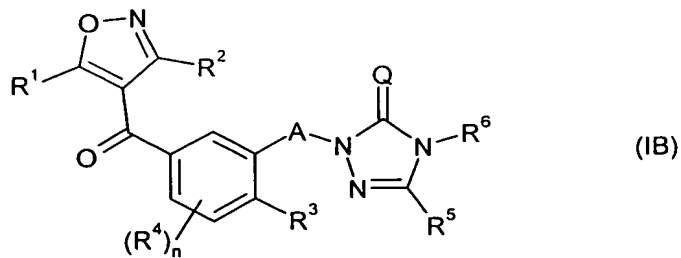
12. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 11 mit der allgemeinen Formel (IA)



in welcher

n, A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> die in einem der Ansprüche 1 bis 11 angegebene Bedeutung haben.

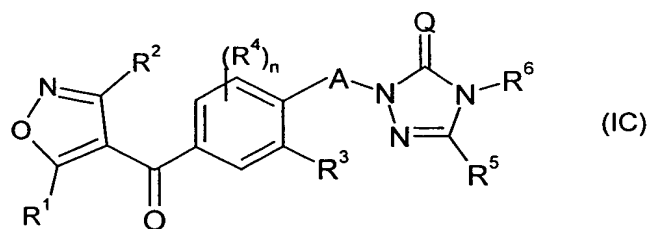
13. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 11 mit der allgemeinen Formel (IB)



in welcher

n, A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> die in einem der Ansprüche 1 bis 11 angegebene Bedeutung haben.

14. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 11 mit der allgemeinen Formel (IC)



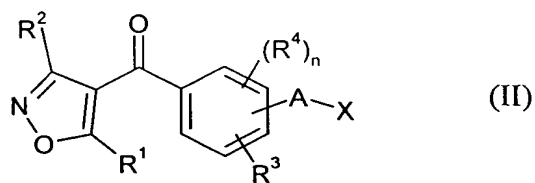
in welcher

5 n, A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> die in einem der Ansprüche 1 bis 11 angegebene Bedeutung haben.

15. Verfahren zum Herstellen von Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 14, dadurch gekennzeichnet, daß man

10

(a) Benzoylisoxazole der allgemeinen Formel (II)



in welcher

n, A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> die in einem der Ansprüche 1 bis 5, 7, 8, 10 und 11 angegebene Bedeutung haben und

X für Halogen steht,

20

mit Heterocyclen der allgemeinen Formel (III)

H-Z (III)

in welcher

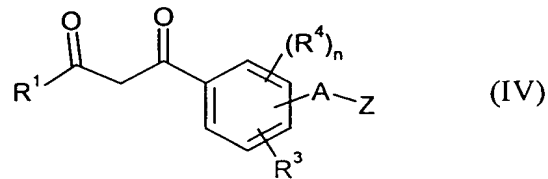
Z die in einem der Ansprüche 1 und 2 angegebene Bedeutung hat,

5 gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und  
gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel  
umsetzt,

oder daß man

10 - für den Fall, daß  $R^2$  für Wasserstoff steht -

(b) Benzoylketone der allgemeinen Formel (IV)



15

in welcher

20 n, A,  $R^1$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  und Z die in einem der Ansprüche 1 bis 5, 7, 10 und 11 ange-  
gebene Bedeutung haben,

mit einem Orthoameisensäureester oder einem N,N-Dimethyl-formamid-  
acetal

und anschließend mit Hydroxylamin oder einem Säureaddukt hiervon

25

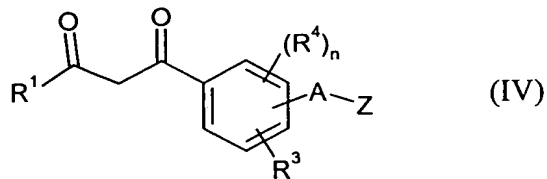
gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und  
gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel  
umsetzt,

oder daß man

- für den Fall, daß  $R^2$  für gegebenenfalls substituiertes Alkoxy-carbonyl steht -

5

(c) Benzoylketone der allgemeinen Formel (IV)



in welcher

10

$n$ ,  $A$ ,  $R^1$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  und  $Z$  die in einem der Ansprüche 1 bis 5, 7, 10 und 11 angegebene Bedeutung haben,

mit einem Cyanoameisensäureester

15

und anschließend mit Hydroxylamin oder einem Säureaddukt hiervon

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umgesetzt,

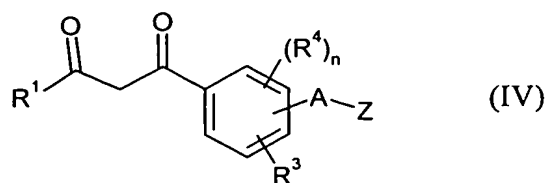
20

oder daß man

für den Fall das  $R^2$  für Alkylthio steht -

25

(d) Benzoylketone der allgemeinen Formel (IV)



in welcher

5 n, A, R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und Z die in einem der Ansprüche 1 bis 5, 7, 10 und 11 angegebene Bedeutung haben,

mit Carbondisulfid (Schwefelkohlenstoff) und mit einem Alkylierungsmittel

10 und anschließend mit Hydroxylamin oder einem Säureaddukt hiervon

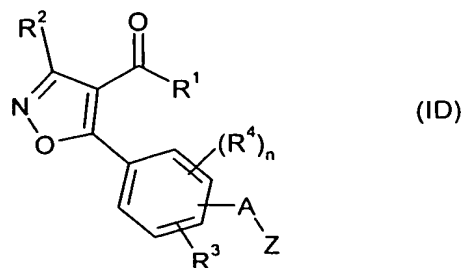
gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und  
gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel  
umsetzt,

15

und gegebenenfalls im Anschluß daran an den gemäß Verfahren (a) bis (d) erhaltenen Verbindungen der Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise elektrophile oder nucleophile Substitutionsreaktionen bzw. Oxidations- oder Reduktionsreaktionen durchführt.

20

16. Verbindungen der allgemeinen Formel (ID)

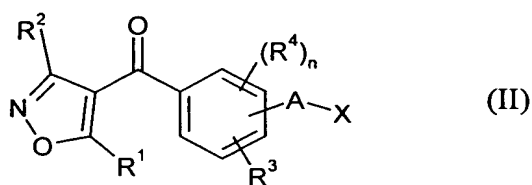


in welcher

n, A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und Z die in einem der Ansprüche 1 bis 5, 7, 8, 10 und 11 angegebene Bedeutung haben.

5

17. Verbindungen der allgemeinen Formel (II) mit Ausnahme von 4-(2-Brom-methyl-benzoyl)-5-cyclopropyl-isoxazol-3-carbonsäure-ethylester



10

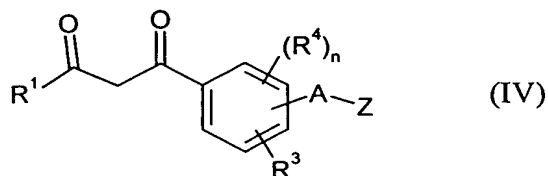
in welcher

n, A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> die in einem der Ansprüche 1 bis 5, 7, 8, 10 und 11 angegebene Bedeutung haben und

15

X für Halogen steht.

18. Verbindungen der allgemeinen Formel (IV)



20

in welcher

n, A, R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und Z die in einem der Ansprüche 1 bis 5, 7, 10 und 11 angegebene Bedeutung haben.

25

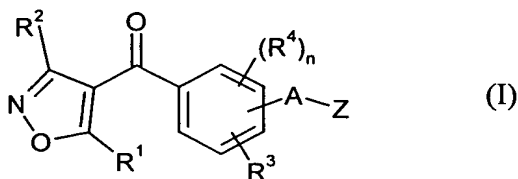


19. Herbizide Mittel, gekennzeichnet durch den Gehalt mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 14 und üblichen Streckmitteln.
  20. Verwendung von mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 14 zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen.
- 5

# Substituierte Benzoylisoxazole

## Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft neue substituierte Benzoylisoxazole der allgemeinen Formel (I),



in welcher

n für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3 steht,

A für eine Einfachbindung oder für Alkandiyl (Alkylen) steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl oder Cycloalkyl steht,

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxy carbonyl oder Alkylthio steht,

R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht,

- R<sup>4</sup> Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht, und
- Z für eine gegebenenfalls substituierte 4- bis 12-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische, heterocyclische Gruppierung steht, welche 1 bis 4 Heteroatome (bis zu 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls - alternativ oder additiv - ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom, oder eine SO-Gruppierung oder eine SO<sub>2</sub>-Gruppierung) enthält, und welche zusätzlich ein bis drei Oxo-Gruppen (C=O) und/oder Thioxo-Gruppen (C=S) als Bestandteile des Heterocyclus enthält,

sowie Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

**This Page Blank (uspto)**



Creation date: 05-05-2004  
Indexing Officer: TNGUYEN64 - TUAN NGUYEN  
Team: OIPEBackFileIndexing  
Dossier: 09980666

Legal Date: 10-04-2002

No.	Doccode	Number of pages
1	FOR	54
2	FOR	56
3	FOR	90
4	FOR	118
5	FOR	46
6	FOR	30

Total number of pages: 394

Remarks:

Order of re-scan issued on .....

